

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2017-512206
(P2017-512206A)

(43) 公表日 平成29年5月18日 (2017.5.18)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 487/04 (2006.01)	C07D 487/04 140	4C050
A61K 31/5025 (2006.01)	C07D 487/04 CSP	4C086
A61P 31/00 (2006.01)	A61K 31/5025	4H011
AO1N 43/90 (2006.01)	A61P 31/00	
	AO1N 43/90 103	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 109 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2016-568095 (P2016-568095)
 (86) (22) 出願日 平成27年2月6日 (2015.2.6)
 (85) 翻訳文提出日 平成28年8月5日 (2016.8.5)
 (86) 国際出願番号 PCT/CN2015/072369
 (87) 国際公開番号 W02015/117563
 (87) 国際公開日 平成27年8月13日 (2015.8.13)
 (31) 優先権主張番号 14154347.0
 (32) 優先日 平成26年2月7日 (2014.2.7)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(71) 出願人 300091441
 シンジェンタ パーティシペーションズ
 アーゲー
 スイス国4058 バーゼル、シュバルツ
 バルトアレー 215
 (71) 出願人 516237499
 シンジェンタ (チャイナ) インヴェス
 トメント カンパニー リミテッド
 中華人民共和国 200120 シャンハ
 イ プードン ディストリクト プー
 ドン サウス ロード 999 シンメイ
 ユニオン スクエア 21/エフ
 (74) 代理人 100086771
 弁理士 西島 孝喜

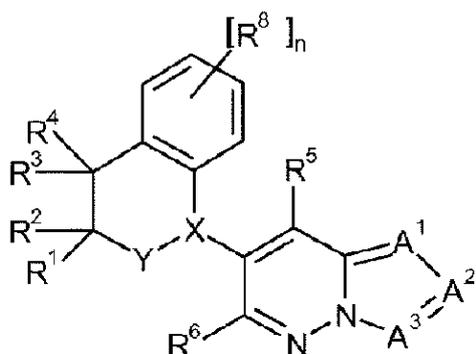
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 殺微生物二環式複素環式誘導体

(57) 【要約】

式 I の化合物

【化 1】



(I)

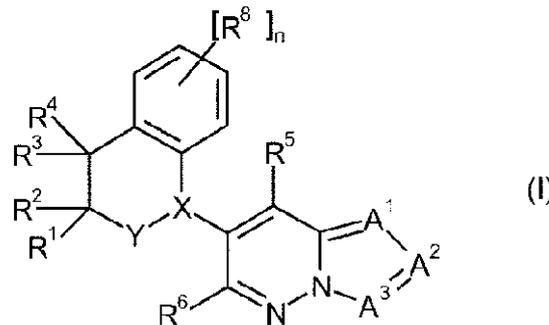
(式中、Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、A¹、A²、A³、R_aおよび n は、請求項 1 に定義されているとおりである) が提供されている。さらに、本発明は、式 (I) の化合物を含む農芸化学組成物、これらの組成物の調製、ならびに、特に真菌といった植物病原性微生物による植物、収穫された食品作物、種子または非生体材料の外寄生を駆除、予防または防除するための農業または園芸における化合物または組成物の使

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



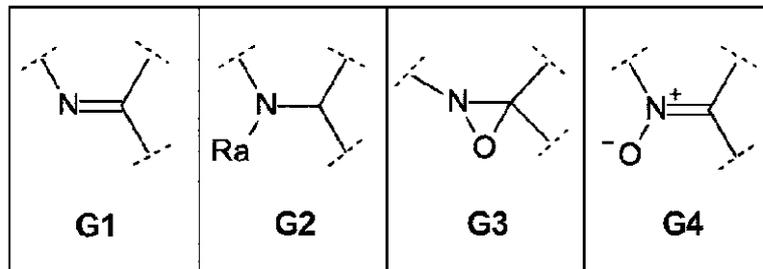
10

(式中、

A¹、A²およびA³の各々は、独立して、窒素原子またはCR⁷を表し；

Y - Xは、G1、G2、G3およびG4から選択されるラジカルを表し；

【化 2】



20

R¹およびR²は各々、水素、ハロゲン、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオおよびフェノキシから独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；または

R¹およびR²は、これらが結合している炭素原子と一緒に、C₃~C₁₀シクロアルキル基（これは、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得る）を表し；

R³およびR⁴は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオおよびフェノキシから独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；または

R³およびR⁴は、これらが結合している炭素原子と一緒に、C=O、C=CH₂またはC₃~C₁₀シクロアルキル（これは、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得る）を表し；

R⁵は、水素、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシまたはヒドロキシルであり；

R⁶は、水素、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシまたはヒドロキシルであり；

各R⁷は独立して、水素、シアノ、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルキニルまたはヒドロキ

50

シルを表し；

各 R⁸は独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、C₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルケニルオキシ、C₃~C₆アルキニルオキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₂~C₆アルキニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルカルボニル、NH(C₁~C₆アルキル)、N(C₁~C₆アルキル)₂、CO₂H、CO₂(C₁~C₆アルキル)、C(O)N(C₁~C₆アルキル)₂、C(O)NH(C₁~C₆アルキル)、C(O)NH₂、NH(C₁~C₆アルキルカルボニル)、N(C₁~C₆アルキルカルボニル)₂、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシまたはヘテロアリールオキシを表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシ、ヒドロキシル、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆アルコキシカルボニルおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、前記アリールまたはヘテロアリール基は、ハロゲン、C₁~C₆アルキル(これ自体は、1~3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る)、C₁~C₆アルコキシ、アミノ(これ自体は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニルから独立して選択される1個または2個の基で置換され得る)、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、メルカプトおよびC₁~C₆アルキルチオからなる群から独立して選択される1~5個の置換基で任意選択により置換され得；nは0、1、2、3または4であり；

R^aは、水素、C₁~C₆アルキルカルボニルまたはC₁~C₆アルキルであり、これは、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得る)または、その塩もしくはN-オキシド。

【請求項2】

A₁、A₂およびA₃の1つ以上がCR⁷を表す、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

各R⁷が独立して、水素、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₂~C₆アルキニルまたはヒドロキシルを表す、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

Y-Xが、G1、G2またはG4である、請求項1、2または3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

R¹およびR²が各々、水素、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；または、R¹およびR²が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C₃~C₆シクロアルキル基を表す、請求項1、2、3または4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R³およびR⁴が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシから独立して選択され、ここで、前記アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシおよびC₁~C₆アルキルチオから独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；または、R³およびR⁴が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C=OまたはC₃~C₇シクロアルキル(これは、ハロゲンから独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得る)を表す、請求項1、2、3、4または5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R⁵が、水素、ハロゲンまたはC₁~C₆アルキルである、請求項1、2、3、4、5または6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

R⁶が、水素、ハロゲンまたはC₁~C₆アルキルである、請求項1、2、3、4、5、

10

20

30

40

50

6 または 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

各 R^8 が独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、前記フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（これ自体は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）または $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で任意選択により置換され得；n が、0、1、2、または 3 である、請求項 1、2、3、4、5、6、7 または 8 のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項 10】

Y - X が G 2 である場合、 R^a が水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項 1、2、3、4、5、6、7、8 または 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

請求項 1 に記載の化合物であって、 A_1 、 A_2 および A_3 の 2 つ以上が CR^7 を表し；各 R^7 が独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはヒドロキシルを表し；Y - X が G 1 であり； R^1 および R^2 が各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、ここで、前記アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、 R^1 および R^2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表し； R^3 および R^4 が各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 R^3 および R^4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ またはシクロプロピルを表し； R^5 が水素またはハロゲンであり； R^6 が水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；各 R^8 が独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）を表し、ここで、前記アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、前記フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（これ自体は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）からなる群から独立して選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で任意選択により置換され得；n が、0、1 または 2 であり；ならびに、 R^a が水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルである化合物、または、その塩もしくは N - オキシド。

20

30

【請求項 12】

植物病原性病害の駆除、予防または防除方法であって、植物病原体、前記植物病原体の生息地、または、植物病原体による被害を受けやすい植物、または、その繁殖体に、殺菌・殺力比的に有効な量の請求項 1 ~ 11 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物、または、殺菌・殺力比的に有効な量の請求項 1 ~ 11 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物を含む組成物を適用するステップを含む方法。

40

【請求項 13】

殺菌・殺力比的に有効な量の請求項 1 ~ 11 のいずれかに定義されている式 (I) の化合物を含む組成物。

【請求項 14】

前記組成物が、少なくとも 1 種の追加の活性処方成分および / または希釈剤をさらに含

50

む、請求項 1 3 に記載の組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、例えば、特に殺菌・殺カビ活性といった殺微生物活性を有する活性処方成分としての殺微生物二環式複素環式誘導体に関する。本発明はまた、これらの二環式複素環式誘導体の調製、これらの二環式複素環式誘導体の調製に有用な中間体、これらの中間体の調製、少なくとも 1 種の二環式複素環式誘導体を含む農芸化学組成物、これらの組成物の調製、および、農業または園芸における、植物、収穫された食品作物、種子または非生物材料に対する特に真菌といった植物病原性微生物による外寄生を防除もしくは予防するための二環式複素環式誘導体または組成物の使用に関する。

10

【背景技術】

【0002】

一定の殺菌・殺カビヘテロ二環式化合物が国際公開第 05070917 号パンフレットに記載されている。

【0003】

意外なことに、一定の新規二環式複素環式誘導体が有利な殺菌・殺カビ特性を有することがここに見いだされた。

【発明の概要】

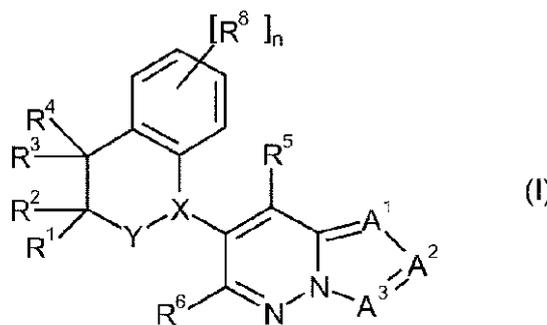
【課題を解決するための手段】

20

【0004】

本発明は従って、式 I の化合物

【化 1】



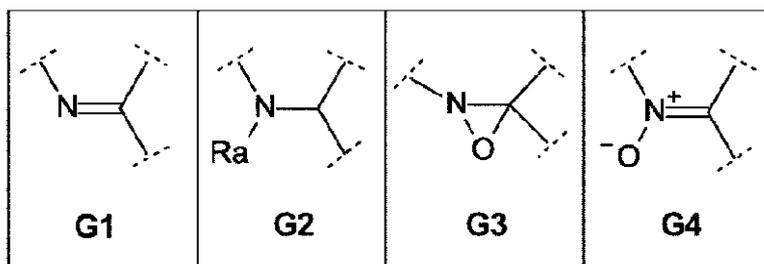
30

(式中、

A¹、A²および A³の各々は、独立して、窒素原子または C R⁷を表し；

Y - X は、G 1、G 2、G 3 および G 4 から選択されるラジカルを表し；

【化 2】



40

R¹および R²は各々、水素、ハロゲン、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₃~C₇シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニルから独立して選択され、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオおよびフェノキシから独立して選択される 1~3 個の置換基で任意選択により置換され得；または

50

R^1 および R^2 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル基（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得る）を表し；

R^3 および R^4 は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルから独立して選択され、ここで、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アルケニルおよびアルキニル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオおよびフェノキシから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得；または

R^3 および R^4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$ 、 $C=CH_2$ または $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得る）を表し；

R^5 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたはヒドロキシルであり；

R^6 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたはヒドロキシルであり；

各 R^7 は独立して、水素、シアノ、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたはヒドロキシルを表し；

各 R^8 は独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 CO_2H 、 $CO_2(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $C(O)N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $C(O)NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $C(O)NH_2$ 、 $NH(C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル)、 $N(C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル) $_2$ 、アリーール、ヘテロアリーール、アリーールオキシまたはヘテロアリーールオキシを表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、アリーールまたはヘテロアリーール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（これ自体は、1～3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アミノ（これ自体は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルから独立して選択される1個または2個の基で置換され得る）、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、メルカプトおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオからなる群から独立して選択される1～5個の置換基で任意選択により置換され得； n は0、1、2、3または4であり；

R^a は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオおよびフェノキシからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得る）または、その塩もしくはN-オキシドを提供する。

【発明を実施するための形態】

【0005】

第2の態様において、本発明は、式(I)の化合物を含む農芸化学組成物を提供する。

【0006】

式(I)の化合物は植物病原性微生物の防除に用いられ得る。それ故、植物病原体を防除するために、本発明に係る式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物は、植物病原体に直接、または、植物病原体の生息地（特に植物病原体による被害を受けやすい植物）に適用され得る。

【0007】

10

20

30

40

50

それ故、第3の態様において、本発明は、植物病原体を防除するための本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【0008】

さらなる態様において、本発明は、本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原体、または、前記植物病原体の生息地(特に植物病原体による被害を受けやすい植物)に適用するステップを含む植物病原体の防除方法を提供する。

【0009】

式(I)の化合物は、植物病原性真菌の防除に特に効果的である。

【0010】

それ故、さらなる態様において、本発明は、植物病原性真菌を防除するための本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物の使用を提供する。

【0011】

さらなる態様において、本発明は、本明細書に記載の式(I)の化合物または式(I)の化合物を含む組成物を、前記植物病原性真菌、または、前記植物病原性真菌の生息地(特に植物病原性真菌による被害を受けやすい植物)に適用するステップを含む植物病原性真菌の防除方法を提供する。

【0012】

置換基が任意選択により置換されていると示されている場合、これは、これらの置換基が、1個以上の同等もしくは異なる置換基、例えば1~3個の置換基を有していてもいなくてもよいことを意味する。通常、3個以下のこのような任意選択の置換基が同時に存在する。1個の基が置換されていると示されている場合(例えばアルキル)、これは、他の基の一部であるこれらの基を含む(例えばアルキルチオ中のアルキル)。

【0013】

「ハロゲン」という用語は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を指し、好ましくはフッ素、塩素または臭素を指す。

【0014】

アルキル置換基は直鎖または分岐であり得る。アルキルは、それ自体、または、他の置換基の一部として、記載されている炭素原子の数に応じて、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、*n*-ブチル、*n*-ペンチル、*n*-ヘキシルおよびこれらの異性体、例えば、イソ-プロピル、イソ-ブチル、*sec*-ブチル、*t*-ブチルまたはイソ-アミルである。

【0015】

アルケニル置換基は直鎖または分岐鎖の形態であることが可能であり、このアルケニル部分は、適切な場合、(E)-または(Z)-立体構成のものであることが可能である。例はビニルおよびアリルである。アルケニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_2 \sim C_4$ 、および、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルケニル基である。

【0016】

アルキニル置換基は、直鎖または分岐鎖の形態であることが可能である。例はエチニルおよびプロパルギルである。アルキニル基は、好ましくは $C_2 \sim C_6$ 、より好ましくは $C_2 \sim C_4$ 、および、最も好ましくは $C_2 \sim C_3$ アルキニル基である。

【0017】

ハロアルキル基は1個以上の同等または異なるハロゲン原子を含有し得、例えば、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CF_3CH_2 、 CH_3CF_2 、 CF_3CF_2 または CCl_3CCl_2 を表し得る。

【0018】

ハロアルケニル基はそれぞれアルケニル基であり、これらは、1つ以上の同一または異なるハロゲン原子で置換されており、例えば、2,2-ジフルオロビニルまたは1,2-ジクロロ-2-フルオロ-ビニルである。

【0019】

10

20

30

40

50

ハロアルキニル基はそれぞれアルキニル基であり、これらは、1つ以上の同一または異なるハロゲン原子で置換されており、例えば1-クロロ-プロブ-2-イニルである。

【0020】

アルコキシはラジカル-ORを意味し、式中、例えば上記に定義されているとおり、Rはアルキルである。アルコキシ基としては、これらに限定されないが、メトキシ、エトキシ、1-メチルエトキシ、プロポキシ、ブトキシ、1-メチルプロポキシおよび2-メチルプロポキシが挙げられる。

【0021】

シアノは-CN基を意味する。

【0022】

アミノは-NH₂基を意味する。

【0023】

ヒドロキシルまたはヒドロキシは、-OH基を指す。

【0024】

アリール基(単独で、または、例えばアリールオキシ、アリール-アルキルなどのより大きな基の一部として)は、単環式、二環式または三環式の形態であることが可能である芳香族環系である。このような環の例としては、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニルまたはフェナントレニルが挙げられる。好ましいアリール基はフェニルおよびナフチルであり、フェニルが最も好ましい。アリール部分が置換されていると言われる場合、このアリール部分は、好ましくは1~4個の置換基、最も好ましくは1~3個の置換基で置換されている。

【0025】

ヘテロアリール基(単独で、または、例えばヘテロアリールオキシ、ヘテロアリール-アルキルなどのより大きな基の一部として)は、少なくとも1個のヘテロ原子を含有すると共に、単一の環または2つ以上の縮合環から構成される芳香族環系である。好ましくは、単一の環は3個以下のヘテロ原子を含有し、二環系は4個以下のヘテロ原子を含有することとなり、これらは、窒素、酸素および硫黄から好ましく選択されることとなる。単環式基の例としては、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル(例えば[1,2,4]トリアゾリル)、フラニル、チオフェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアゾリル、イソチアゾリルおよびチアジアゾリルが挙げられる。二環式基の例としては、プリニル、キノリニル、シノリニル、キノキサリニル、インドリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチオフェニルおよびベンゾチアゾリルが挙げられる。単環式ヘテロアリール基が好ましく、ピリジルが最も好ましい。ヘテロアリール部分が置換されていると言われる場合、このヘテロアリール部分は、好ましくは1~4個の置換基、最も好ましくは1~3個の置換基で置換されている。

【0026】

ヘテロシクリル基または複素環(単独で、または、ヘテロシクリル-アルキルなどのより大きな基の一部として)は、O、SおよびNから選択される1個以上(好ましくは1個、2個または3個)のヘテロ原子を含む10個以下の原子を含有する非芳香族環構造である。単環式基の例としては、オキセタニル、4,5-ジヒドロ-イソオキサゾリル、チエタニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、[1,3]ジオキサラニル、ピペリジニル、ピペラジニル、[1,4]ジオキサニル、イミダゾリジニル、[1,3,5]オキサジアジナニル、ヘキサヒドロ-ピリミジニル、[1,3,5]トリアジナニルおよびモルホリニル、または、1-オキソ-チエタニルおよび1,1-ジオキソ-チエタニルなどのこれらの酸化型が挙げられる。二環式基の例としては、2,3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、ベンゾ[1,4]ジオキサラニル、ベンゾ[1,3]ジオキサラニル、クロメニルおよび2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシニルが挙げられる。ヘテロシクリル部分が置換されていると言われる場合、このヘテロシクリル部分は、好ましくは1~4個の置換基、最も好ましくは1~3個の置換基で置換されている。

10

20

30

40

50

【0027】

式 I の化合物中に 1 個以上の不斉炭素原子の存在が可能であるとは、その化合物が光学異性形態、すなわち、鏡像異性形態またはジアステレオ異性形態をとり得ることを意味する。また、単結合に係る回転の制限によってアストロブ異性体が生じ得る。式 I は、すべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含むことが意図されている。本発明は、式 I の化合物に係るすべてのこれらの可能性のある異性形態およびその混合物を含む。同様に、式 I は、すべての可能性のある互変異性体を含むことが意図されている。本発明は、式 I の化合物に係るすべての可能性のある互変異性形態を含む。

【0028】

各事例において、本発明に係る式 I の化合物は、遊離形態、N - オキシドとしての酸化型、または、例えば農業経済学的に使用可能な塩形態といった塩形態である。

10

【0029】

N - オキシドは、第三級アミンの酸化型、または、窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N - oxides”, A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991 に記載されている。

【0030】

Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、A¹、A²、A³、R^a および n の好ましい値は、任意のこれらの組み合わせで、以下に規定されているとおりである。

【0031】

好ましくは、A₁、A₂ および A₃ の 1 つ以上は CR⁷ を表す。

20

【0032】

より好ましくは、A₁、A₂ および A₃ の 2 つ以上は CR⁷ を表す。

【0033】

さらにより好ましくは、A₁ は窒素原子であり、ならびに、A₂ および A₃ は共に CR⁷ を表し、または、A₂ は窒素原子であり、ならびに、A₁ および A₃ は共に CR⁷ を表す。

【0034】

最も好ましくは、A₁、A₂ および A₃ はすべて CR⁷ を表す。

【0035】

好ましくは、各 R⁷ は独立して、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₂ ~ C₆ アルキニルまたはヒドロキシルを表す。

30

【0036】

より好ましくは、各 R⁷ は独立して、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルキルまたはヒドロキシルを表す。

【0037】

さらにより好ましくは、各 R⁷ は独立して、水素またはハロゲンを表す。

【0038】

最も好ましくは、各 R⁷ は独立して、水素、フルオロまたはクロロであり、ここで、2 つ以上の R⁷ 基がフルオロまたはクロロであることはない。

40

【0039】

好ましくは、Y - X は、G₁、G₂ または G₄ である。

【0040】

より好ましくは、Y - X は G₁ または G₂ である。

【0041】

最も好ましくは、Y - X は G₁ である。

【0042】

好ましくは、R¹ および R² は各々、水素、シアノ、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルコキシおよび C₁ ~ C₆ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置

50

換基で任意選択により置換され得；または、 R^1 および R^2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表す。

【0043】

より好ましくは、 R^1 および R^2 は各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得；または、 R^1 および R^2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表す。

【0044】

さらにより好ましくは、 R^1 および R^2 は各々 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 R^1 および R^2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロピル基を表す。

10

【0045】

最も好ましくは、 R^1 および R^2 は各々 $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択される。

【0046】

好ましくは、 R^3 および R^4 は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択され、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得；または、 R^3 および R^4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ もしくは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、ハロゲンから独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得る）を表す。

20

【0047】

より好ましくは、 R^3 および R^4 は各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 R^3 および R^4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ またはシクロプロピルを表す。

【0048】

さらにより好ましくは、 R^3 および R^4 は各々、水素、フルオロもしくはメチルから独立して選択され；または、 R^3 および R^4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ を表す。

【0049】

最も好ましくは、 R^3 および R^4 は各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択される。

30

【0050】

好ましくは、 R^5 は、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0051】

より好ましくは、 R^5 は水素またはハロゲンである。

【0052】

さらにより好ましくは、 R^5 は水素、クロロまたはフルオロである。

【0053】

最も好ましくは、 R^5 は水素である。

【0054】

好ましくは、 R^6 は、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである；

40

【0055】

より好ましくは、 R^6 は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0056】

さらにより好ましくは、 R^6 は水素またはメチルである。

【0057】

最も好ましくは、 R^6 は水素である。

【0058】

好ましくは、各 R^8 は独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、

50

$C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシルからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（これ自体は、1～3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）または $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される1～5個の置換基で任意選択により置換され得；nは、0、1、2、または3である。

10

【0059】

より好ましくは、各 R^8 は独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）を表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（これ自体は、1～3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）からなる群から独立して選択される1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換され得；nは、0、1または2である。

20

【0060】

さらにより好ましくは、各 R^8 は独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、フェニル、ピリジル、フェノキシまたはピリジリオキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニルおよびピリジル基はハロゲンからなる群から独立して選択される1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換され得；nは0、1または2である。

【0061】

最も好ましくは、各 R^8 は独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意選択により置換され得；nは0または1、最も好ましくは0である。

30

【0062】

好ましくは、 R^a は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0063】

最も好ましくは、 R^a は水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

【0064】

本発明に係る実施形態は以下に規定されているとおり提供される。

【0065】

実施形態1は、上記に定義されているとおり、式Iの化合物、または、その塩もしくはN-オキシドを提供する。

40

【0066】

実施形態2は実施形態1に記載の化合物を提供するものであり、式中、 A_1 、 A_2 および A_3 の1つ以上は CR^7 を表す。

【0067】

実施形態3は実施形態1または2に記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R^7 は独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたはヒドロキシルを表す。

【0068】

50

実施形態 4 は実施形態 1、2 または 3 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、Y - X は G 1、G 2 または G 4 である。

【0069】

実施形態 5 は実施形態 1、2、3 または 4 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、R¹ および R² は各々、水素、シアノ、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルコキシおよび C₁ ~ C₆ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、R¹ および R² は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C₃ ~ C₆ シクロアルキル基を表す。

【0070】

実施形態 6 は実施形態 1、2、3、4 または 5 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、R³ および R⁴ は各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシから独立して選択され、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルコキシおよび C₁ ~ C₆ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、R³ および R⁴ は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、C = O または C₃ ~ C₇ シクロアルキル（これは、ハロゲンから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得る）を表す。

【0071】

実施形態 7 は実施形態 1、2、3、4、5 または 6 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、R⁵ は、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₆ アルキルである。

【0072】

実施形態 8 は実施形態 1、2、3、4、5、6 または 7 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、R⁶ は、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₆ アルキルである。

【0073】

実施形態 9 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7 または 8 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R⁸ は独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₂ ~ C₆ アルケニルオキシ、C₃ ~ C₆ アルキニルオキシ、C₁ ~ C₆ アルキルチオ、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルカルボニル、フェニル、ヘテロアリアル（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリアルオキシ（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルコキシ、ヒドロキシルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリアル基は、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルキル（これ自体は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）または C₁ ~ C₆ アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で任意選択により置換され得；n は、0、1、2、または 3 である。

【0074】

実施形態 10 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8 または 9 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、Y - X が G 2 である場合、R^a は水素または C₁ ~ C₆ アルキルである。

【0075】

実施形態 11 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、A₁、A₂ および A₃ の 2 つ以上は C R⁷ を表す。

【0076】

実施形態 12 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10 または 11 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R⁷ は独立して、水素、ハロゲ

10

20

30

40

50

ン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはヒドロキシルを表す。

【0077】

実施形態13は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11または12のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $Y-X$ はG1またはG2である。

【0078】

実施形態14は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12または13のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^1 および R^2 は各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基は、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；または、 R^1 および R^2 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表す。

10

【0079】

実施形態15は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13または14のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^3 および R^4 は各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 R^3 および R^4 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ もしくはシクロプロピルを表す。

【0080】

実施形態16は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14または15のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^5 は水素またはハロゲンである。

20

【0081】

実施形態17は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15または16のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^6 は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0082】

実施形態18は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16または17のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R^8 は独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル、ヘテロアリール（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリールオキシ（式中、ヘテロアリールは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）を表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲンからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリール基は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（これ自体は、1~3個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）からなる群から独立して選択される1個もしくは2個の置換基で任意選択により置換され得； n は、0、1または2である。

30

【0083】

実施形態19は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17または18のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $Y-X$ がG2である場合、 R^9 は水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

40

【0084】

実施形態20は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18または19のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、A1は窒素原子であり、および、A2およびA3は共に CR^7 を表し、または、A2は窒素原子であり、および、A1およびA3は共に CR^7 を表す。

【0085】

実施形態21は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19または20のいずれか1つに記載の化合物を提

50

供するものであり、式中、各 R^7 は独立して、水素またはハロゲンを表す。

【0086】

実施形態 22 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20 または 21 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^1 および R^2 は各々 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 R^1 および R^2 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、シクロプロピル基を表す。

【0087】

実施形態 23 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21 または 22 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^3 および R^4 は各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択され；または、 R^3 および R^4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $C=O$ を表す。

10

【0088】

実施形態 24 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22 または 23 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^5 は、水素、クロロまたはフルオロである。

【0089】

実施形態 25 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23 または 24 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^6 は水素またはメチルである。

20

【0090】

実施形態 26 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24 または 25 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R^8 は独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、フェニル、ピリジル、フェノキシまたはピリジルオキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニルおよびピリジル基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で任意選択により置換され得； n は 0、1 または 2 である。

30

【0091】

実施形態 27 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25 または 26 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 A_1 、 A_2 および A_3 はすべては CR^7 を表す。

【0092】

実施形態 28 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26 または 27 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R^7 は独立して、水素、フルオロまたはクロロを表し、ここで、2 つ以上の R^7 基がフルオロまたはクロロであることはない。

40

【0093】

実施形態 29 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27 または 28 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 $Y-X$ は G1 である。

【0094】

実施形態 30 は実施形態 1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28 または 29 のいずれか 1 つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^1 および R^2 は

50

各々、 $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択される。

【0095】

実施形態31は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29または30のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^3 および R^4 は各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択される。

【0096】

実施形態32は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30または31のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^5 は水素である。

10

【0097】

実施形態33は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31または32のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、 R^6 は水素である。

【0098】

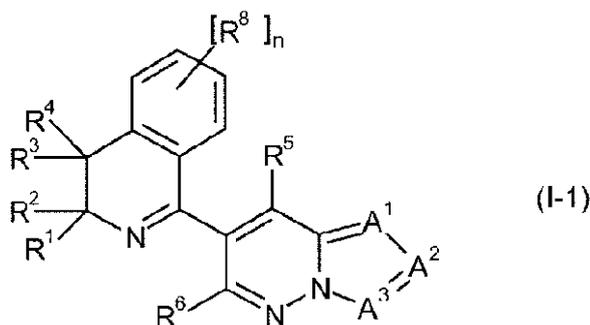
実施形態34は実施形態1、2、3、4、5、6、7、8、9、11、12、13、14、15、16、17、18、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30、31、32または33のいずれか1つに記載の化合物を提供するものであり、式中、各 R^8 は独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で任意選択により置換され得；nは0または1、最も好ましくは0である。

20

【0099】

本発明に係る化合物の好ましい群は式I-1のものであり、

【化3】



30

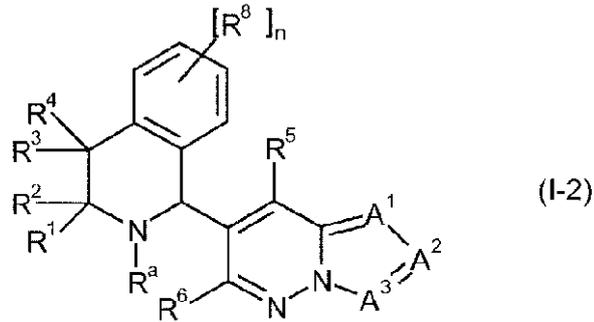
式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 およびnは、式Iの化合物、または、その塩もしくはN-オキシドに定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 およびnの好ましい定義は、式Iの化合物に定義されているとおりである。

40

【0100】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式I-2のものであり、

【化4】



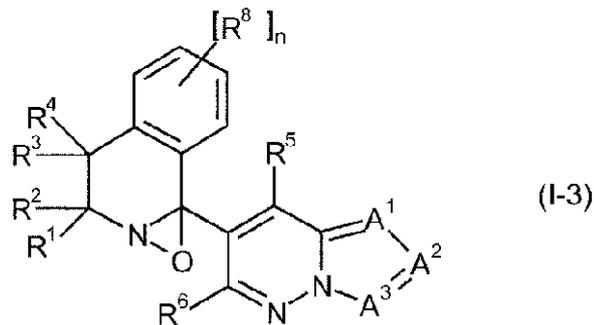
10

式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 R^a および n は、式Iの化合物、または、その塩もしくはN-オキッドに定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 R^a および n の好ましい定義は、式Iの化合物に定義されているとおりである。

【0101】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式I-3のものであり、

【化5】



20

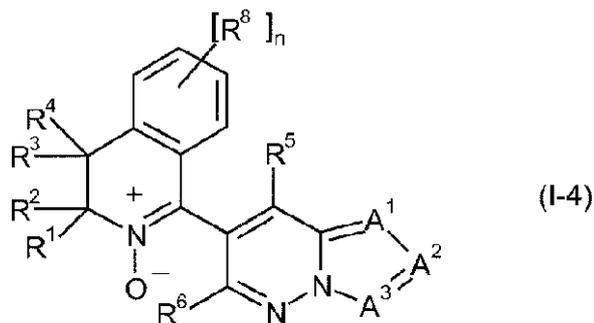
式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は、式Iの化合物、または、その塩もしくはN-オキッドに定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n の好ましい定義は、式Iの化合物に定義されているとおりである。

30

【0102】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式I-4のものであり、

【化6】



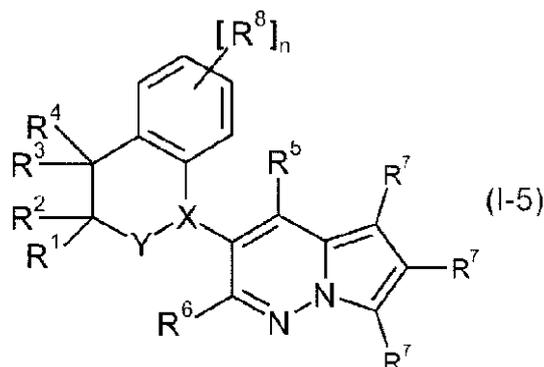
40

式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は、式Iの化合物、または、その塩もしくはN-オキッドに定義されているとおりである。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n の好ましい定義は、式Iの化合物に定義されているとおりである。

【0103】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式I-5のものであり、

【化 7】



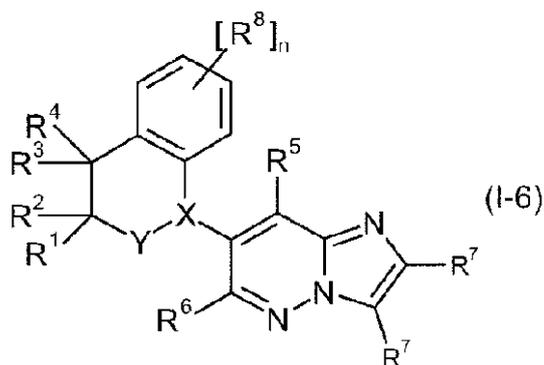
10

式中、Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、Ra および n は、式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドに定義されているとおりである。Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、Ra および n の好ましい定義は、式 I の化合物に定義されているとおりである。

【0104】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 6 のものであり、

【化 8】



20

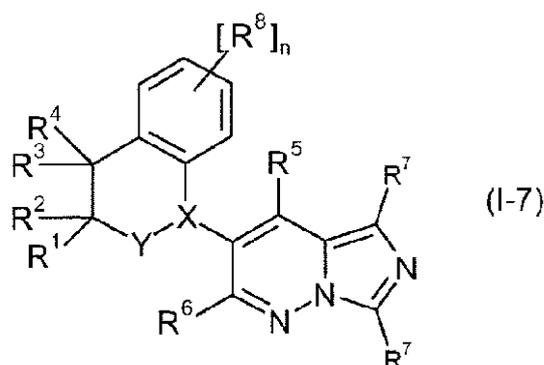
式中、Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、Ra および n は、式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドに定義されているとおりである。Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、Ra および n の好ましい定義は、式 I の化合物に定義されているとおりである。

30

【0105】

他の本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 7 のものであり、

【化 9】



40

式中、Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、Ra および n は、式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドに定義されているとおりである。Y - X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、Ra および n の好ましい定義は、式 I の化合物

50

に定義されているとおりである。

【0106】

さらなる本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 8 のものであり、これは、 A_1 、 A_2 および A_3 の 1 つ以上が CR^7 を表し；各 R^7 が独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルまたはヒドロキシルを表し； $Y - X$ が G_1 、 G_2 または G_4 であり； R^1 および R^2 が各々、水素、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、アルキルおよびシクロアルキル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、 R^1 および R^2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表し； R^3 および R^4 が各々、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択され、ここで、アルキルおよびアルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルチオから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、 R^3 および R^4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ または $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル（これは、ハロゲンから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得る）を表し； R^5 が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり； R^6 が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；各 R^8 が独立して、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、フェニル、ヘテロアリアル（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリアルオキシ（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニル、チアゾリル、イミダゾリルまたはオキサゾリルである）を表し、ここで、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリアル基は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル（これ自体は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）または $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で任意選択により置換され得； n が、0、1、2、または 3 であり；ならびに、 R^a が水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルである式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドである。

10

20

30

【0107】

さらなる本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 9 のものであり、これは、 A_1 、 A_2 および A_3 の 2 つ以上が CR^7 を表し；各 R^7 が独立して、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたはヒドロキシルを表し； $Y - X$ が G_1 または G_2 であり； R^1 および R^2 が各々、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され、ここで、アルキル基はハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；または、 R^1 および R^2 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル基を表し； R^3 および R^4 が各々、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択され；または、 R^3 および R^4 が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C=O$ またはシクロプロピルを表し； R^5 が水素またはハロゲンであり； R^6 が水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；各 R^8 が独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル、ヘテロアリアル（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）、フェノキシまたはヘテロアリアルオキシ（式中、ヘテロアリアルは、ピリジル、チオフェニルまたはチアゾリルである）を表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニル、フェノキシおよびヘテロアリアル基は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_3$ アルキル（これ自体は、1 ~ 3 個のハロゲン原子で任意選択により置換され得る）からなる群から独立して選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で任意選択により置換され得； n が、0、1 または 2 であり；ならびに、 R^a が水素または $C_1 \sim C_2$

40

50

アルキルである、式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドである。

【0108】

さらなる本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 10 のものであり、これは、A₁ が窒素原子であり、および、A₂ および A₃ が共に C R⁷ を表し、または、A₂ が窒素原子であり、および、A₁ および A₃ が共に C R⁷ を表し；各 R⁷ が独立して水素またはハロゲンを表し；Y - X が G₁ または G₂ であり；R¹ および R² が各々 C₁ ~ C₆ アルキルから独立して選択され；または、R¹ および R² が、これらが結合している炭素原子と一緒になってシクロプロピル基を表し；R³ および R⁴ が各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択され；または、R³ および R⁴ が、これらが結合している炭素原子と一緒になって C = O を表し；R⁵ が、水素、クロロまたはフルオロであり；R⁶ が水素またはメチルであり；各 R⁸ が独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、C₁ ~ C₃ アルキル、C₁ ~ C₃ アルコキシ、フェニル、ピリジル、フェノキシまたはピリジロキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得、ならびに、フェニルおよびピリジル基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で任意選択により置換され得；n が 0、1 または 2 であり；ならびに、R^a が水素または C₁ ~ C₂ アルキルである式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドである。

10

【0109】

さらなる本発明に係る化合物の好ましい群は式 I - 11 のものであり、これは、A₁、A₂ および A₃ がすべて C R⁷ を表し；各 R⁷ が独立して、水素、フルオロまたはクロロを表し、ここで、2 つ以上の R⁷ 基がフルオロまたはクロロであることはなく；Y - X が G₁ であり；R¹ および R² が各々 C₁ ~ C₂ アルキルから独立して選択され；R³ および R⁴ が各々、水素、フルオロまたはメチルから独立して選択され；R⁵ が水素であり；R⁶ が水素であり；各 R⁸ が独立して、フルオロ、クロロ、プロモ、C₁ ~ C₃ アルキル、C₁ ~ C₃ アルコキシを表し、ここで、アルキルおよびアルコキシ基はハロゲンからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択により置換され得；n が 0 または 1、最も好ましくは 0 である式 I の化合物、または、その塩もしくは N - オキシドである。

20

【0110】

本発明に係る化合物は、とりわけ、真菌によって引き起こされる病害に対する植物の保護に係る有利なレベルの生物学的活性、または、農芸化学活性処方成分としての使用に係る優れた特性（例えば、高い生物学的活性、有利な活性スペクトル、高い安全プロファイル、向上した物理化学的特性または高い生分解性）を含む、多数の有益性を有し得る。

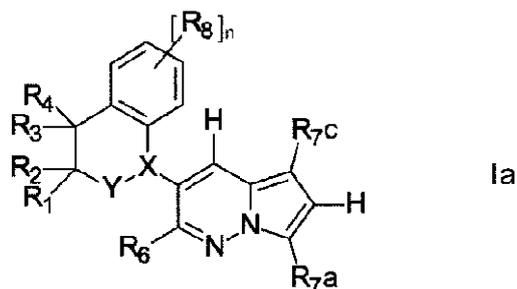
30

【0111】

式 I の化合物の特定の例が、以下の表 A 1 ~ A 27、B 1 ~ B 10 および C 1 ~ C 12 に例示されている。

表 A 1 は 232 種の式 I a の化合物を提供するものであり、

【化 10】



40

式中、R₆、R_{7a} および R_{7c} はすべて H であり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は、以下の表 Z に定義されているとおりである。

【0112】

【表 1 - 1】

表 Z

項目	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₈	Y-X	Ra
1	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
2	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G1	-
3	CH ₃	CH ₃	H	H	6-F	G1	-
4	CH ₃	CH ₃	H	H	7-F	G1	-
5	CH ₃	CH ₃	H	H	8-F	G1	-
6	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Cl	G1	-
7	CH ₃	CH ₃	H	H	6-Cl	G1	-
8	CH ₃	CH ₃	H	H	7-Cl	G1	-
9	CH ₃	CH ₃	H	H	8-Cl	G1	-
10	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Br	G1	-
11	CH ₃	CH ₃	H	H	6-Br	G1	-
12	CH ₃	CH ₃	H	H	7-Br	G1	-
13	CH ₃	CH ₃	H	H	8-Br	G1	-
14	CH ₃	CH ₃	H	H	5-I	G1	-
15	CH ₃	CH ₃	H	H	5,6-F ₂	G1	-
16	CH ₃	CH ₃	H	H	5,6-Cl ₂	G1	-
17	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F-6-Cl	G1	-
18	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₃	G1	-
19	CH ₃	CH ₃	H	H	6-CH ₃	G1	-
20	CH ₃	CH ₃	H	H	7-CH ₃	G1	-
21	CH ₃	CH ₃	H	H	8-CH ₃	G1	-
22	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₂ CH ₃	G1	-
23	CH ₃	CH ₃	H	H	5-C≡CH	G1	-
24	CH ₃	CH ₃	H	H	5-C(H)=CH ₂	G1	-
25	CH ₃	CH ₃	H	H	5-シクロプロピル	G1	-
26	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CN	G1	-
27	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OH	G1	-
28	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OCH ₃	G1	-
29	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OC ₆ H ₅	G1	-
30	CH ₃	CH ₃	H	H	5-O-(ピリド-2-イル)	G1	-
31	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₂ OCH ₃	G1	-
32	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OCHF ₂	G1	-
33	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OCF ₃	G1	-
34	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OCH ₂ C(H)=CH ₂	G1	-
35	CH ₃	CH ₃	H	H	5-OCH ₂ C≡CH	G1	-
36	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CF ₃	G1	-
37	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CHF ₂	G1	-
38	CH ₃	CH ₃	H	H	5-C ₆ H ₆	G1	-
39	CH ₃	CH ₃	H	H	5-(2-F-C ₆ H ₅)	G1	-
40	CH ₃	CH ₃	H	H	5-(チエン-2-イル)	G1	-
41	CH ₃	CH ₃	H	H	5-(チアゾール-2-イル)	G1	-

10

20

30

40

【表 1 - 2】

42	CH ₃	CH ₃	H	H	5-NH ₂	G1	-
43	CH ₃	CH ₃	H	H	5-NHC(O)CH ₃	G1	-
44	CH ₃	CH ₃	H	H	5-C(O)H	G1	-
45	CH ₃	CH ₃	H	H	5-C(O)OH	G1	-
46	CH ₃	CH ₃	H	H	5-C(O)NH ₂	G1	-
47	CH ₃	CH ₃	H	H	5-C(O)N(CH ₃) ₂	G1	-
48	CH ₃	CH ₃	H	H	5-COCH ₃	G1	-
49	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G2	H
50	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G2	H
51	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Cl	G2	H
52	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₃	G2	H
53	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G2	CH ₃
54	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G2	CH ₃
55	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Cl	G2	CH ₃
56	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₃	G2	CH ₃
57	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G3	-
58	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G3	-
59	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Cl	G3	-
60	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₃	G3	-
61	CH ₃	CH ₃	H	H	H [n=0]	G4	-
62	CH ₃	CH ₃	H	H	5-F	G4	-
63	CH ₃	CH ₃	H	H	5-Cl	G4	-
64	CH ₃	CH ₃	H	H	5-CH ₃	G4	-
65	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H [n=0]	G1	-
66	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	5-F	G1	-
67	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	6-F	G1	-
68	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	5-Cl	G1	-
69	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	6-Cl	G1	-
70	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	5-Br	G1	-
71	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	5-CH ₃	G1	-
72	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	5-OCH ₃	G1	-
73	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	5-OC ₆ H ₅	G1	-
74	CH ₃	CH ₃	H	OH	H [n=0]	G1	-
75	CH ₃	CH ₃	H	OH	5-F	G1	-
76	CH ₃	CH ₃	H	OH	6-F	G1	-
77	CH ₃	CH ₃	H	OH	5-Cl	G1	-
78	CH ₃	CH ₃	H	OH	6-Cl	G1	-
79	CH ₃	CH ₃	H	OH	5-Br	G1	-
80	CH ₃	CH ₃	H	OH	5-CH ₃	G1	-
81	CH ₃	CH ₃	H	OH	5-OCH ₃	G1	-
82	CH ₃	CH ₃	H	OH	5-OC ₆ H ₅	G1	-
83	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	H [n=0]	G1	-
84	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	5-F	G1	-
85	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	6-F	G1	-
86	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	5-Cl	G1	-
87	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	6-Cl	G1	-

10

20

30

40

【表 1 - 3】

88	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	5-Br	G1	-
89	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	5-CH ₃	G1	-
90	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	5-OCH ₃	G1	-
91	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	5-OC ₆ H ₅	G1	-
92	CH ₃	CH ₃	H	F	H [n=0]	G1	-
93	CH ₃	CH ₃	H	F	5-F	G1	-
94	CH ₃	CH ₃	H	F	6-F	G1	-
95	CH ₃	CH ₃	H	F	5-Cl	G1	-
96	CH ₃	CH ₃	H	F	6-Cl	G1	-
97	CH ₃	CH ₃	H	F	5-Br	G1	-
98	CH ₃	CH ₃	H	F	5-CH ₃	G1	-
99	CH ₃	CH ₃	H	F	5-OCH ₃	G1	-
100	CH ₃	CH ₃	H	F	5-OC ₆ H ₅	G1	-
101	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
102	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G1	-
103	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	6-F	G1	-
104	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-Cl	G1	-
105	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	6-Cl	G1	-
106	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-Br	G1	-
107	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5,6-F ₂	G1	-
108	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5,6-Cl ₂	G1	-
109	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F-6-Cl	G1	-
110	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CH ₃	G1	-
111	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CH ₂ CH ₃	G1	-
112	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-C(O)H	G1	-
113	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CN	G1	-
114	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OH	G1	-
115	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OCH ₃	G1	-
116	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OC ₆ H ₅	G1	-
117	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-O-(ピリド-2-イル)	G1	-
118	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CH ₂ OCH ₃	G1	-
119	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-C ₆ H ₆	G1	-
120	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-(2-F-C ₆ H ₅)	G1	-
121	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-(チエン-2-イル)	G1	-
122	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-(チアゾール-2-イル)	G1	-
123	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OCHF ₂	G1	-
124	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OCF ₃	G1	-
125	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OCH ₂ C(H)=CH ₂	G1	-
126	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-OCH ₂ C≡CH	G1	-
127	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CF ₃	G1	-
128	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-CHF ₂	G1	-
129	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G2	H
130	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G2	H
131	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G2	CH ₃

10

20

30

40

【表 1 - 4】

132	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G2	CH ₃
133	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G3	-
134	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G3	-
135	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G3	-
136	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G3	-
137	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G4	-
138	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G4	-
139	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G4	-
140	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G4	-
141	CH ₃	CH ₃	=O		H [n=0]	G1	-
142	CH ₃	CH ₃	=O		5-F	G1	
143	CH ₃	CH ₃	=O		6-F	G1	-
144	CH ₃	CH ₃	=O		5-Cl	G1	-
145	CH ₃	CH ₃	=O		6-Cl	G1	-
146	CH ₃	CH ₃	=O		5-Br	G1	-
147	CH ₃	CH ₃	=O		5-CH ₃	G1	-
148	CH ₃	CH ₃	=O		5-OCH ₃	G1	
149	CH ₃	CH ₃	=O		5-OC ₆ H ₅	G1	-
150	CH ₃	CH ₃	F	F	H [n=0]	G1	-
151	CH ₃	CH ₃	F	F	5-F	G1	-
152	CH ₃	CH ₃	F	F	6-F	G1	
153	CH ₃	CH ₃	F	F	5-Cl	G1	-
154	CH ₃	CH ₃	F	F	6-Cl	G1	-
155	CH ₃	CH ₃	F	F	5-Br	G1	-
156	CH ₃	CH ₃	F	F	5-CH ₃	G1	-
157	CH ₃	CH ₃	F	F	5-OCH ₃	G1	-
158	CH ₃	CH ₃	F	F	5-OC ₆ H ₅	G1	-
159	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		H [n=0]	G1	-
160	CH ₃	CH ₃	シクロプロピル		5-F	G1	-
161	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		H [n=0]	G1	-
162	CH ₃	CH ₃	シクロブチル		5-F	G1	-
163	CH ₃	CH ₃	シクロペンチル		H [n=0]	G1	-
164	CH ₃	CH ₃	シクロペンチル		5-F	G1	-
165	CH ₃	CH ₃	シクロヘキシル		H [n=0]	G1	-
166	CH ₃	CH ₃	シクロヘキシル		5-F	G1	-
167	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
168	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-F	G1	-
169	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-Cl	G1	-
170	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-CH ₃	G1	-
171	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-OCH ₃	G1	-
172	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
173	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-F	G1	-
174	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	5-Cl	G1	-
175	CH ₃	CF ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
176	CH ₃	CF ₃	H	H	5-F	G1	-
177	CH ₃	CF ₃	H	H	5-Cl	G1	-

10

20

30

40

【表 1 - 5】

178	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H [n=0]	G1	-
179	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	5-F	G1	-
180	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	5-Cl	G1	-
181	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
182	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	5-F	G1	-
183	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	5-Cl	G1	-
184	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
185	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	H	5-F	G1	-
186	CH ₄	CH ₂ OCH ₃	H	H	5-Cl	G1	-
187	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
188	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	5-F	G1	-
189	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	5-Cl	G1	-
190	CH ₃	H	H	H	H [n=0]	G1	-
191	CH ₃	H	H	H	5-F	G1	-
192	CH ₃	H	H	H	5-CH ₃	G1	-
193	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	H [n=0]	G1	-
194	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	5-F	G1	-
195	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	H	5-Cl	G1	-
196	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	H [n=0]	G1	-
197	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	5-F	G1	-
198	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	5-Cl	G1	-
199	シクロプロピル		H	H	H [n=0]	G1	-
200	シクロプロピル		CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
201	シクロプロピル		= O		H [n=0]	G1	-
202	シクロプロピル		F	F	H [n=0]	G1	-
203	シクロプロピル	シクロプロピル		H [n=0]		G1	-
204	シクロプロピル	H	H	5-F		G1	-
205	シクロプロピル	CH ₃	CH ₃	5-F		G1	-
206	シクロプロピル	= O		5-F		G1	-
207	シクロプロピル	F	F	5-F		G1	-
208	シクロプロピル	シクロプロピル		5-F		G1	-
209	シクロブチル	H	H	H [n=0]		G1	-
210	シクロブチル	CH ₃	CH ₃	H [n=0]		G1	-
211	シクロブチル	= O		H [n=0]		G1	-
212	シクロブチル	F	F	H [n=0]		G1	-
213	シクロブチル	H	H	5-F		G1	-
214	シクロブチル	CH ₃	CH ₃	5-F		G1	-
215	シクロブチル	= O		5-F		G1	-
216	シクロブチル	F	F	5-F		G1	-
217	シクロペンチル	H	H	H [n=0]		G1	-
218	シクロペンチル	CH ₃	CH ₃	H [n=0]		G1	-
219	シクロペンチル	= O		H [n=0]		G1	-
220	シクロペンチル	F	F	H [n=0]		G1	-
221	シクロペンチル	H	H	5-F		G1	-
222	シクロペンチル	CH ₃	CH ₃	5-F		G1	-

10

20

30

40

【表 1 - 6】

223	シクロペンチル	=O		5-F	G1	-
224	シクロペンチル	F	F	5-F	G1	-
225	シクロヘキシル	H	H	H [n=0]	G1	-
226	シクロヘキシル	CH ₃	CH ₃	H [n=0]	G1	-
227	シクロヘキシル	=O		H [n=0]	G1	-
228	シクロヘキシル	F	F	H [n=0]	G1	-
229	シクロヘキシル	H	H	5-F	G1	-
230	シクロヘキシル	CH ₃	CH ₃	5-F	G1	-
231	シクロヘキシル	=O		5-F	G1	-
232	シクロヘキシル	F	F	5-F	G1	-

10

【0113】

表 A 2 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R_{7a}、R_{7c} は H であり、R₆ はメチルであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0114】

表 A 3 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R_{7a}、R_{7c} は H であり、R₆ はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

20

【0115】

表 A 4 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R_{7a}、R_{7c} は H であり、R₆ はクロロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0116】

表 A 5 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R_{7a}、R_{7c} は H であり、R₆ はメトキシであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

30

【0117】

表 A 6 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆、R_{7a} は H であり、R_{7c} はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0118】

表 A 7 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆、R_{7a} は H であり、R_{7c} はヒドロキシルであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0119】

表 A 8 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆、R_{7a} は H であり、R_{7c} はクロロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

40

【0120】

表 A 9 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆、R_{7a} は H であり、R_{7c} はメチルであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0121】

表 A 10 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆、R_{7c} は H であり、R_{7a} はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

50

【0122】

表A11は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はメチルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0123】

表A12は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はクロロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0124】

表A13は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はプロモであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

10

【0125】

表A14は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はシアノであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0126】

表A15は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はヒドロキシルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

20

【0127】

表A16は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はメトキシであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0128】

表A17は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はジフルオロメチルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0129】

表A18は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はエチニルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

30

【0130】

表A19は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はトリフルオロメチルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0131】

表A20は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 、 R_7c はHであり、 R_7a はシクロプロピルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

40

【0132】

表A21は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7c はフルオロであり、 R_7a はフルオロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0133】

表A22は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、 R_7c はヒドロキシルであり、 R_7a はフルオロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0134】

表A23は232種の式Iaの化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はHであり、

50

R_{7c} はメチルであり、R_{7a} はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0135】

表 A 2 4 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ はすべて H であり、R_{7c} はブromoであり、R_{7a} はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0136】

表 A 2 5 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ はすべて H であり、R_{7c} はクロロであり、R_{7a} はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

10

【0137】

表 A 2 6 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ はメトキシであり、R_{7c} は H であり、R_{7a} はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

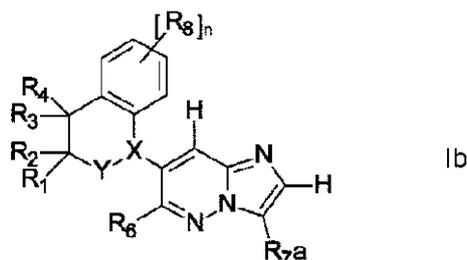
【0138】

表 A 2 7 は 2 3 2 種の式 I a の化合物を提供するものであり、式中、R₆ はメチルであり、R_{7c} は H であり、R_{7a} はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0139】

表 B 1 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を開示するものであり、
【化 1 1】

20



式中、R₆ および R_{7a} は H であり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

30

【0140】

表 B 2 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、R_{7a} は H であり、R₆ はメチルであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0141】

表 B 3 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、R_{7a} は H であり、R₆ はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0142】

表 B 4 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、R_{7a} は H であり、R₆ はクロロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

40

【0143】

表 B 5 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、R_{7a} は H であり、R₆ はメトキシであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0144】

表 B 6 は 2 3 2 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、R₆ は H であり、R_{7a} はフルオロであり、また、式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₈ およびラジカル Y - X の値

50

は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0145】

表 B 7 は 232 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 R_6 は H であり、 R_{7a} はメチルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0146】

表 B 8 は 232 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 R_6 は H であり、 R_{7a} はメトキシであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0147】

表 B 9 は 232 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 R_6 は H であり、 R_{7a} はクロロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

10

【0148】

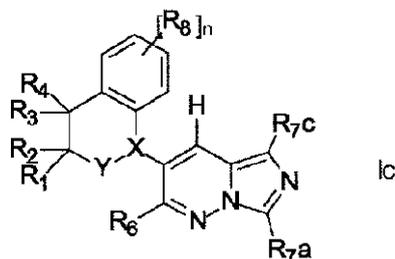
表 B 10 は 232 種の式 I b の化合物を提供するものであり、式中、 R_6 はメチルであり、 R_{7a} はフルオロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0149】

表 C 1 は 232 種の式 I c の化合物を開示するものであり、

【化12】

20



式中、 R_6 、 R_{7a} 、 R_{7c} はすべて H であり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

30

【0150】

表 C 2 は 232 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 R_{7a} 、 R_{7c} はすべて H であり、 R_6 はメチルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0151】

表 C 3 は 232 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 R_{7a} 、 R_{7c} はすべて H であり、 R_6 はフルオロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0152】

表 C 4 は 232 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 R_{7a} 、 R_{7c} はすべて H であり、 R_6 はクロロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

40

【0153】

表 C 5 は 232 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 R_{7a} 、 R_{7c} はすべて H であり、 R_6 はメトキシであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

【0154】

表 C 6 は 232 種の式 I c の化合物を提供するものであり、式中、 R_{7a} 、 R_6 はすべて H であり、 R_{7c} はメチルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカル Y - X の値は上記の表 Z に定義されているとおりである。

50

【0155】

表C7は232種の式Icの化合物を提供するものであり、式中、 R_{7a} 、 R_6 はすべてHであり、 R_{7c} はヒドロキシルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0156】

表C8は232種の式Icの化合物を提供するものであり、式中、 R_{7c} 、 R_6 はすべてHであり、 R_{7a} はフルオロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0157】

表C9は232種の式Icの化合物を提供するものであり、式中、 R_{7c} 、 R_6 はすべてHであり、 R_{7a} はメチルであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

10

【0158】

表C10は232種の式Icの化合物を提供するものであり、式中、 R_{7c} 、 R_6 はすべてHであり、 R_{7a} はメトキシであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0159】

表C11は232種の式Icの化合物を提供するものであり、式中、 R_{7c} 、 R_6 はすべてHであり、 R_{7a} はクロロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

20

【0160】

表C12は232種の式Icの化合物を提供するものであり、式中、 R_{7c} はHであり、 R_6 はメチルであり、 R_{7a} はフルオロであり、また、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_8 およびラジカルY-Xの値は上記の表Zに定義されているとおりである。

【0161】

本発明の化合物は以下のスキームに示されているとおり形成可能であり、ここで、別段の定めがある場合を除き、各可変項の定義は、式(I)の化合物について上記に定義されているとおりである。

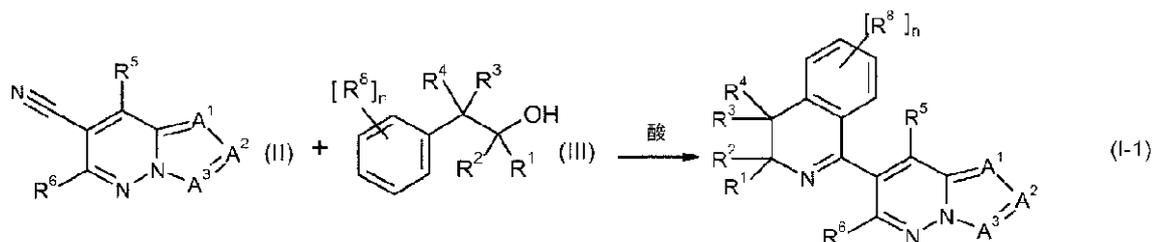
【0162】

式I-1の化合物(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 およびnは式Iに定義されているとおりである)は、式IIの化合物(式中、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 A^2 および A^3 は式Iに定義されているとおりである)の式IIIの化合物(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 およびnは式Iに定義されているとおりである)を伴う酸性条件下での、例えば硫酸、トリフルオロ酢酸またはトリフルオロメタンスルホン酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム1に示されている。

30

【化13】

スキーム1



40

【0163】

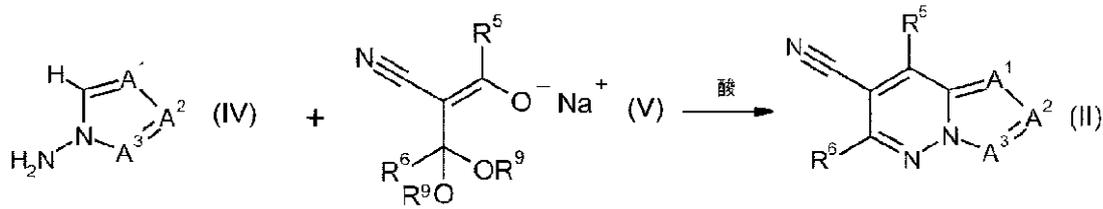
式IIの化合物(式中、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 A^2 および A^3 は式Iに定義されているとおりである)は、式IVの化合物(これは市販されているか、または、多様な公知の方法により容易に入手可能である)(式中、 A^1 、 A^2 および A^3 は式Iに定義されているとおりである)の式Vの化合物(式中、 R^5 および R^6 は式Iに定義されているとおりであり、および、 R^9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである)を伴う酸条件下での、例えば塩酸を伴う変換によ

50

り得ることが可能である。これはスキーム 2 に示されている。

【化 1 4】

スキーム 2



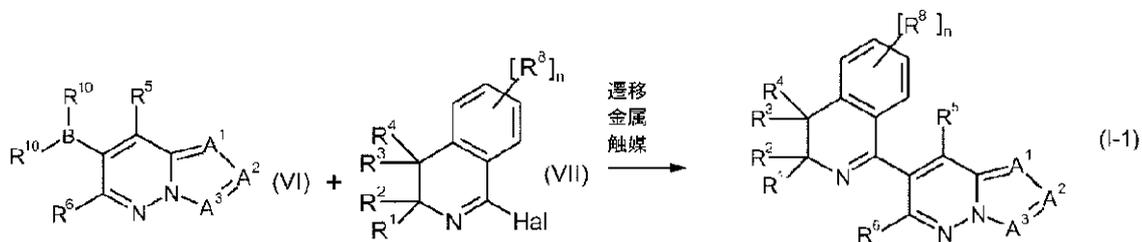
10

【0164】

あるいは、式 I - 1 の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである) は、式 VI の化合物 (式中、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 A^2 および A^3 は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 R^{10} はヒドロキシルであるか、または、2 つの R^{10} は間に介在するホウ素原子と一緒になって 5 員または 6 員飽和複素環を形成する) の式 VII の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 Hal はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである) を伴う、鈴木 - 宮浦反応の条件下における変換により得ることが可能である。これはスキーム 3 に示されている。

【化 1 5】

スキーム 3



20

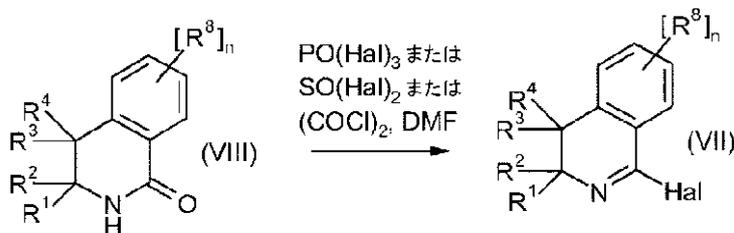
【0165】

式 VII の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 Hal はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである) は、式 VII I の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりである) の、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、塩化チオニル、臭化チオニルまたはヴィルスマイヤー試薬などのハロゲン化試薬を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 4 に示されている。

30

【化 1 6】

スキーム 4



40

【0166】

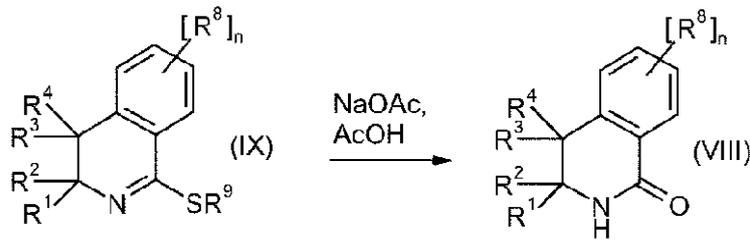
式 VII I の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりである) は、式 IX の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 R^9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである) の酢酸中の酢酸ナトリウムを伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 5 に示されてい

50

る。

【化 17】

スキーム 5



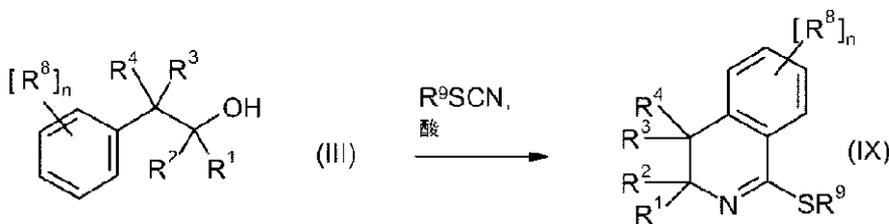
10

【0167】

式 IX の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 R^9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）は、式 III の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりである）の $C_1 \sim C_6$ アルキルチオシアネートを伴う酸性条件下での、例えば硫酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 6 に示されている。

【化 18】

スキーム 6



20

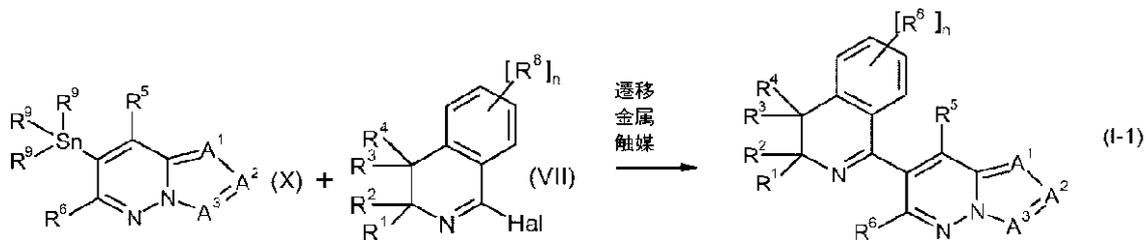
【0168】

あるいは、式 I - 1 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 X の化合物（式中、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 A^2 および A^3 は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 R^9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルである）の式 VII の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりであり、ならびに、 Hal はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）を伴う、スティル反応の条件下での変換により得ることが可能である。これはスキーム 7 に示されている。

30

【化 19】

スキーム 7



40

【0169】

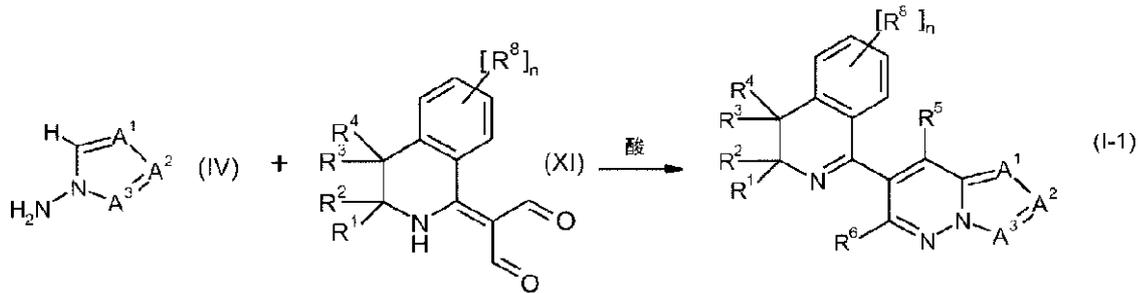
あるいは、式 I - 1 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 IV の化合物（式中、 A^1 、 A^2 および A^3 は式 I に定義されているとおりである）の式 XI の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりである）を伴う酸性条件下での

50

、例えば塩酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 8 に示されている。

【化 2 0】

スキーム 8



10

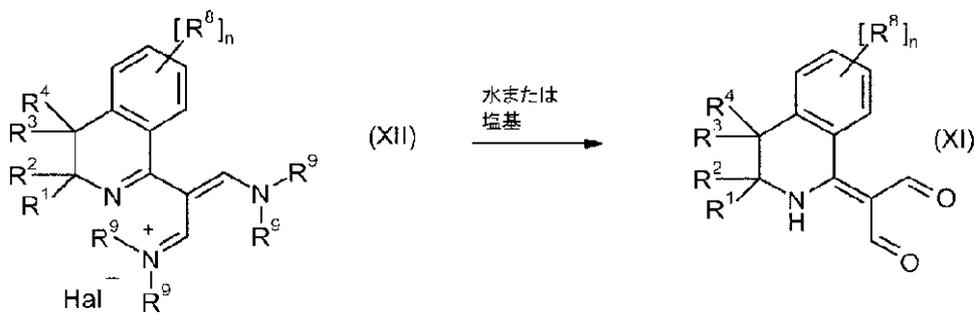
【0170】

式 X I の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 X I I の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりであり、 R^9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ならびに、 Hal はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）の水性または塩基性条件下での変換により得ることが可能である。これはスキーム 9 に示されている。

20

【化 2 1】

スキーム 9



30

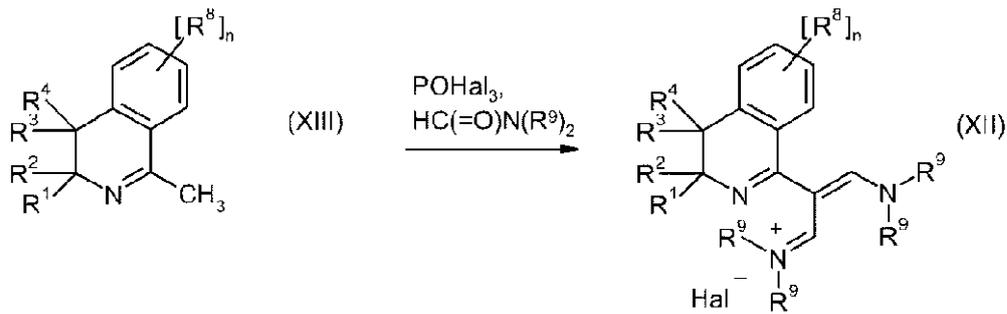
【0171】

式 X I I の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりであり、 R^9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ならびに、 Hal はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）は、式 X I I I の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりであり、 R^9 は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、ならびに、 Hal はハロゲン、好ましくはクロロもしくはプロモである）のオキシ塩化リンまたはオキシ臭化リンなどのオキシハロゲン化リンおよび N, N -ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) ホルムアミドを伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 10 に示されている。

40

【化 2 2】

スキーム 10



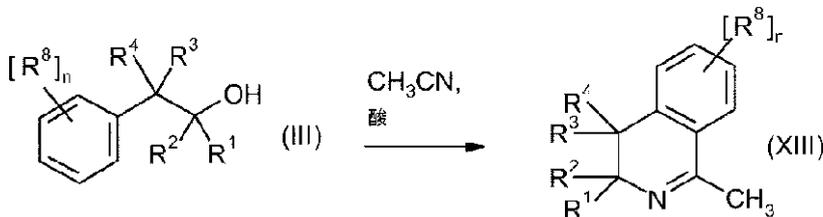
10

【 0 1 7 2】

式 X I I I の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 I I I の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 および n は式 I に定義されているとおりである）のアセトニトリルを伴う酸性条件下での、例えば硫酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 11 に示されている。

【化 2 3】

スキーム 11



20

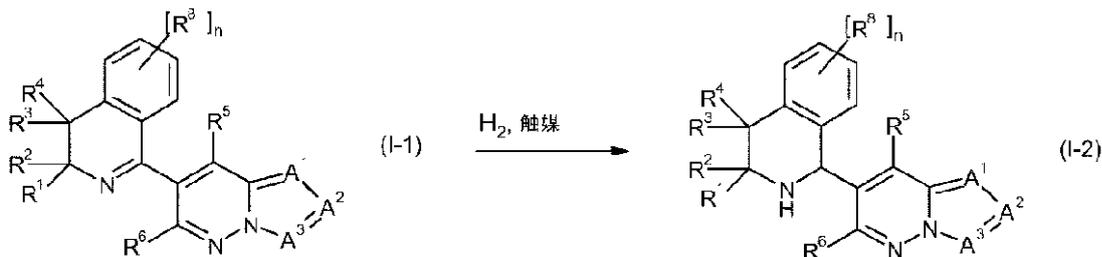
【 0 1 7 3】

式 I - 2 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 I - 1 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）の還元性の反応条件下での、例えば水素および触媒を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 12 に示されている。化合物 I - 2 中のテトラヒドロイソキノリンの環窒素は、 $C_1 \sim C_6$ ハロゲン化アルキルおよび塩基との反応によりアルキル化（ $R^a = C_1 \sim C_6$ アルキル）されるか、または、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルハロゲン化物および塩基を伴う変換によりアシル化（ $R^a = C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル）されることが可能である。

30

【化 2 4】

スキーム 12



40

【 0 1 7 4】

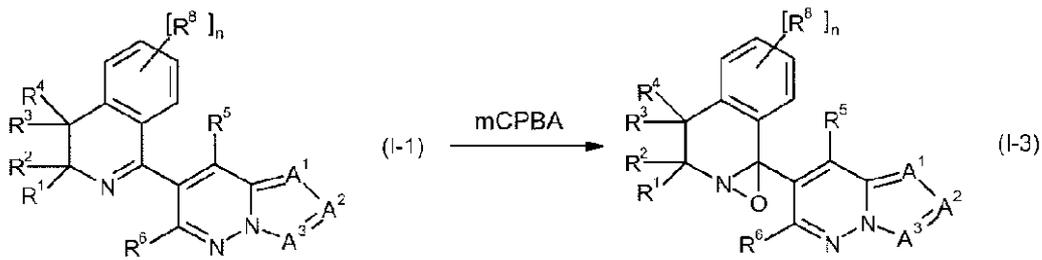
式 I - 3 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 I - 1 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）の酸化性の反応条件下での、例えばメタクロロ過安息香酸を伴う変換により得ることが可

50

能である。これはスキーム 13 に示されている。

【化 25】

スキーム 13



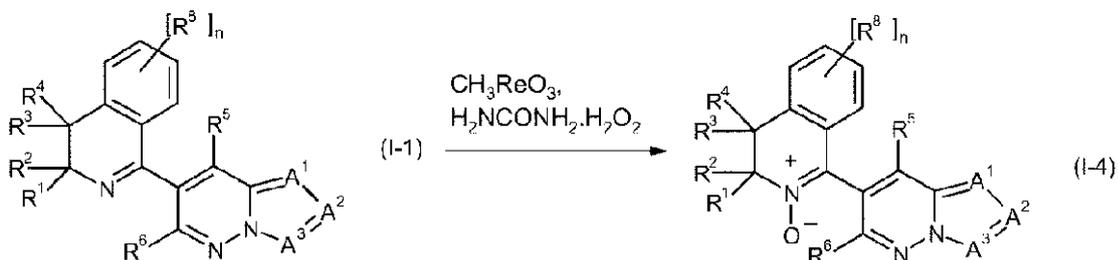
10

【0175】

式 I - 4 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 I - 1 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）の酸化性の反応条件下での、例えばメチルトリオキシレニウムおよび尿素過酸化水素を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 14 に示されている。

【化 26】

スキーム 14



20

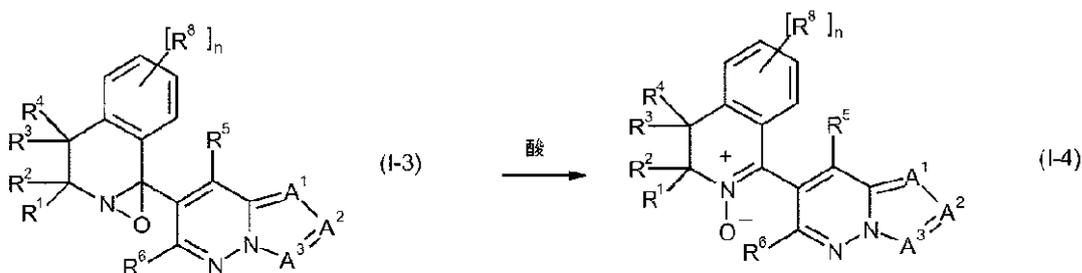
【0176】

あるいは、式 I - 4 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 I - 3 の化合物（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）の酸性条件下での、例えばメタンサルホン酸を伴う変換により得ることが可能である。これはスキーム 15 に示されている。

30

【化 27】

スキーム 15



40

【0177】

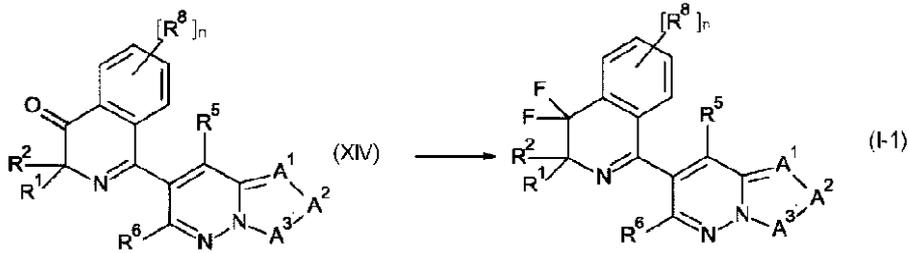
式 I - 1 の化合物（式中、 R^3 および R^4 はフルオロであり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 X I V の化合物（式中、 R^3 および R^4 は、これらが結合している炭素原子と一緒に、 $\text{C}=\text{O}$ を表し、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式 I に定義されているとおりである）の三フッ化ジエチルアミノ硫黄（DAST）または 2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ジメチル - イミダゾリジン（DFI）などのフッ素化試薬を伴う変換

50

により得ることが可能である。これはスキーム 16 に示されている。

【化 28】

スキーム 16



10

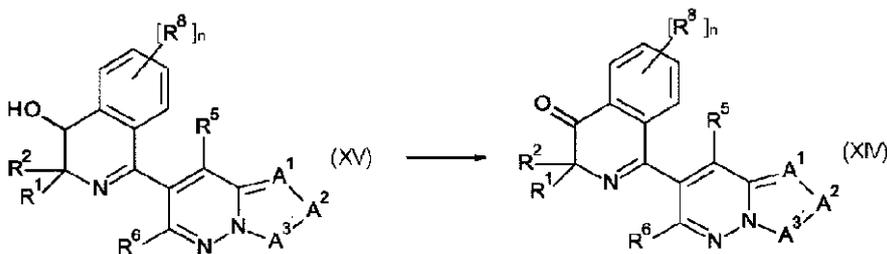
【0178】

式 X I V の化合物（式中、R³ および R⁴ は、これらが結合している炭素原子と一緒に、C=O を表し、ならびに、R¹、R²、R⁵、R⁶、R⁸、A¹、A²、A³ および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 X V の化合物（式中、R³ は水素であり、ならびに、R⁴ はヒドロキシであり、ならびに、R¹、R²、R⁵、R⁶、R⁸、A¹、A²、A³ および n は式 I に定義されているとおりである）の、1, 1, 1 - トリアセトキシ - 1, 1 - ジヒドロ - 1, 2 - ベンズヨードオキソル 3 (1H) - オン（デス・マーチン・ペルヨージナン）などの酸化剤を伴う変換により、または、塩化オキサリル、ジメチルスルホキシド（DMSO）およびトリエチルアミンなどの有機塩基（スワーン酸化）を用いる変換により得ることが可能である。これはスキーム 17 に示されている。

20

【化 29】

スキーム 17



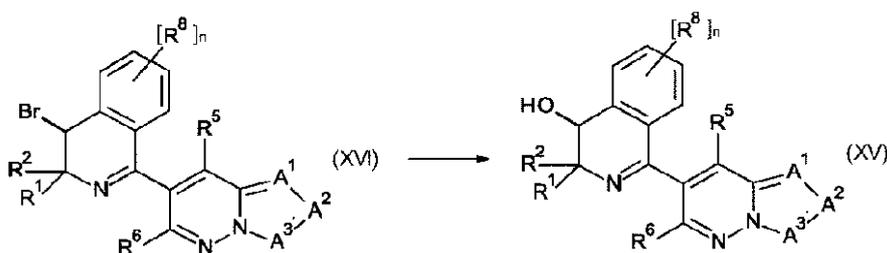
30

【0179】

式 X V の化合物（式中、R³ は水素であり、ならびに、R⁴ はヒドロキシであり、ならびに、R¹、R²、R⁵、R⁶、R⁸、A¹、A²、A³ および n は式 I に定義されているとおりである）は、式 X V I の化合物（式中、R³ は水素であり、ならびに、R⁴ はプロモであり、ならびに、R¹、R²、R⁵、R⁶、R⁸、A¹、A²、A³ および n は式 I に定義されているとおりである）の加水分解条件下での変換により得ることが可能である。これはスキーム 18 に示されている。

【化 30】

スキーム 18



40

【0180】

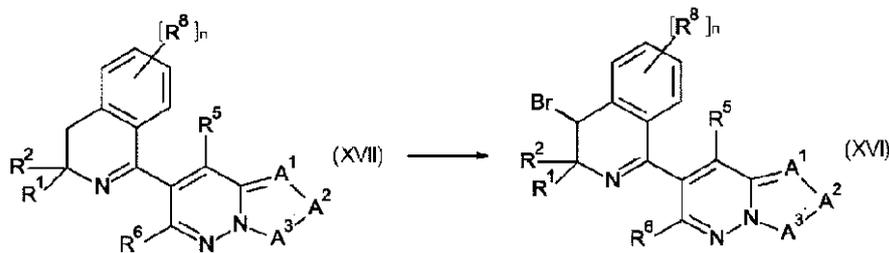
式 X V I の化合物（式中、R³ は水素であり、ならびに、R⁴ はプロモであり、ならびに

50

、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式Iに定義されているとおりである)は、式XVIIの化合物(式中、 R^3 および R^4 は水素であり、ならびに、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式Iに定義されているとおりである)の、N-ブロモハロスクシンイミド(NBS)または1,3-ジブロモ-5,5-ジメチルヒダントインなどの臭素化剤を伴う、アゾビスイソブチロニトリル(AIBN)などのラジカル開始剤の存在下での変換により得ることが可能である。これはスキーム19に示されている。

【化31】

スキーム19



10

【0181】

式XVIIの化合物は、スキーム1に記載の方法に従って得ることが可能である。

【0182】

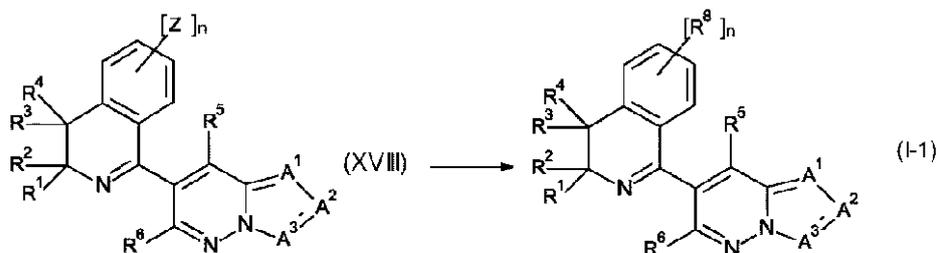
あるいは、式I-1の化合物(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式Iに定義されているとおりである)は、式XVIIIの化合物(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式Iに定義されているとおりであり、ならびに、 Z は溶液中の臭素またはヨウ素を表す)の、塩基の存在下もしくは不在下、および、カップリング試薬および金属触媒の存在下における変換により得ることが可能である。カップリング剤、触媒、溶剤および塩基は特に限定されず、“Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)”, edited by Norio Miyaura und S.L. Buchwald (editions Springer)、または、“Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions”, edited by Armin de Meijere and Francois Diederich (editions WILEY-VCH)に記載のものなどの通常のカップリング反応において用いられるものである。これはスキーム20に示されている。

20

30

【化32】

スキーム20



40

【0183】

さらに、一定の式I-1の化合物(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 A^1 、 A^2 、 A^3 および n は式Iに定義されているとおりである)は、他の関連性の高い式I-1の化合物の当業者に公知である標準的な合成技術を用いる変換により得ることが可能である。網羅的ではないが、例としては、酸化反応、還元反応、加水分解反応、カップリング

50

反応、芳香族求核性または求電子性置換反応、求核置換反応、求核性付加反応およびハロゲン化反応が挙げられる。

【0184】

上記のスキームに記載の一定の中間体は新規のものであり、従って、本発明のさらなる態様を構成する。

【0185】

式Iの化合物は、農業部門および関連する使用分野において、例えば、植物有害生物または非生体材料の防除、ヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物の防除に係る活性処方成分として用いられることが可能である。新規化合物は、低施用量での優れた活性、植物による優れた耐容性、および、環境に対して安全であることにより際だ

10

【0186】

式Iの化合物を殺菌・殺カビ剤として用いることも可能である。「殺菌・殺カビ剤」という用語は、本明細書において用いられるところ、真菌の増殖を防除し、変性させ、または、防止する化合物を意味する。「殺菌・殺カビ的に有効な量」という用語は、真菌の増殖に効果をもたらすことが可能である、このような化合物またはこのような化合物の組み

20

【0187】

土壤中で発生する真菌性感染症、ならびに、植物病原性真菌に対する保護のために、例えば果実、塊茎もしくは穀粒などの種子または植物挿穂（例えばイネ）といった植物繁殖体を処理する粉衣剤として式Iの化合物を用いることも可能である。この繁殖体は、植え付け前に式Iの化合物を含む組成物で処理することが可能である：例えば、種子は、播種される前に粉衣されることが可能である。式Iの化合物はまた、種子を液体配合物中に含浸させるか、または、種子を固体配合物でコーティングすることにより穀粒に適用（コー

30

【0188】

さらに、本発明に係る化合物は、例えば、木材および木材系工業用製品を含む工業用材料の保護、食品保管、衛生管理といった関連する分野における真菌の防除に用いられることが可能である。

【0189】

加えて、本発明は、例えば材木、壁板および塗料といった非生体材料を真菌による作用から保護するために用いられることが可能である。

40

【0190】

これらを含む式Iの化合物および殺菌・殺カビ組成物を用いて、広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。これらは、観賞用作物、芝生、野菜、農作物、穀類および果実作物の葉病原体などの広範囲の植物病害の防除において効果的である。

【0191】

防除され得る、これらの病害に係る真菌および真菌媒介物、ならびに、植物病原性バクテリアおよびウイルスは、例えば以下のとおりである。

アブシジアコリムピフェラ (*Absidia corymbifera*)、アルテルナ

50

リア属の一種 (*Alternaria* spp)、アファノミセス属の一種 (*Aphanomyces* spp)、アスコキタ属の一種 (*Ascochyta* spp)、A. フラバス (*A. flavus*)、A. フミガーツス (*A. fumigatus*)、A. ニズランス (*A. nidulans*)、A. ニガー (*A. niger*)、A. テルス (*A. terrus*) を含むアスペルギルス属の一種 (*Aspergillus* spp.)、A. プルランス (*A. pullulans*) を含むアウレオバシジウム属の一種 (*Aureobasidium* spp.)、ブラストミセスデルマチチディス (*Blastomyces dermatitidis*)、ブルメリアグラミニス (*Blumeria graminis*)、プレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*)、B. ドチデア (*B. dothidea*)、B. オブツサ (*B. obtusa*) のボトリオスファエリア属の一種 (*Botryosphaeria* spp.)、B. シネレア (*B. cinerea*) を含むボトリチス属の一種 (*Botrytis* spp.)、C. アルビカンス (*C. albicans*)、C. グラブラータ (*C. glabrata*)、C. クルセイ (*C. krusei*)、C. ルシタニエ (*C. lusitaniae*)、C. パラブシロシス (*C. parapsilosis*)、C. トロピカリス (*C. tropicalis*) のカンジダ属の一種 (*Candida* spp.)、セファロアスクスフラグラン (*Cephaloascus fragrans*)、セラトシスチス属の一種 (*Ceratocystis* spp)、C. アラクジコラ (*C. arachidicola*) を含むセルコスボラ属の一種 (*Cercospora* spp.)、セルコスボリジウムベルソナツム (*Cercosporidium personatum*)、クラドスポリウム属の一種 (*Cladosporium* spp)、クラビセプスブルブレア (*Claviceps purpurea*)、
 コクシジオイデスイミティス (*Coccidioides immitis*)、コクリオボルス属の一種 (*Cochliobolus* spp)、C. ムサエ (*C. musae*) を含むコレトトリカム属の一種 (*Colletotrichum* spp.)、
 クリプトコッカスネオフォルマン (*Cryptococcus neoformans*)、ジアポルテ属の一種 (*Diaporthe* spp)、ジディメラ属の一種 (*Didymella* spp)、ドレックスレラ属の一種 (*Drechslera* spp)、エルシノエ属の一種 (*Elsinoe* spp)、
 エピデルモフィトン属の一種 (*Epidermophyton* spp)、エルウィニアアミロボラ (*Erwinia amylovora*)、E. シコラセアルム (*E. choroacearum*) を含むエリシフェ種 (*Erysiphe* spp.)、
 ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、F. クルモルム (*F. culmorum*)、F. グラミネアルム (*F. graminearum*)、F. ラングセチエ (*F. langsethiae*)、F. モニリホルメ (*F. moniliforme*)、F. オキシスポルム (*F. oxysporum*)、F. プロリフェラツム (*F. proliferatum*)、F. スブグルチナンス (*F. subglutinans*)、F. ソラニ (*F. solani*) を含むフザリウム属の一種 (*Fusarium* spp.)、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、ギベレラフジクロイ (*Gibberella fujikuroi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムムサルム (*Gloeosporium musarum*)、グロメラリングレート (*Glomerella cingulata*)、ガイグナルディアビドウェリイ (*Guignardia bidwellii*)、ギムノスポランギウム ジュニペリ - ヴィルギニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、ヘルミントスポリウム属の一種 (*Helminthosporium* spp)、ヘミレイア属の一種 (*Hemileia* spp)、H. カプスラツム (*H. capsulatum*) を含むヒストプラズマ属の一種 (*Histoplasma* spp.)、ラエチサリアフシホルミス (*Laetisaria fuciformis*)、レプトグラフィウムリンデベルギ (*Leptoglyphium lindbergi*)、レveilラタウリカ (*Leveillula t*

10

20

30

40

50

aurica)、ロフォデルミウムセディチオスム(*Lophodermium seditiosum*)、コムギ赤かび病菌(*Microdochium nivale*)、ミクロスポルム属の一種(*Microsporum spp*)、モニリニア属の一種(*Monilinia spp*)、ムコール属の一種(*Mucor spp*)、コムギ葉枯病菌(*M. graminicola*)、*M. ポミ*(*M. pomi*)を含むミコスファエレラ属の一種(*Mycosphaerella spp.*)、オンコバシジウムテオブロマエオン(*Oncobasidium theobromaenon*)、オフィオストマピセエ(*Ophiostoma piceae*)、パラコジディオイデス属の一種(*Paracoccidioides spp*)、*P. デイジタツム*(*P. digitatum*)、*P. イタリクム*(*P. italicum*)を含むペニシリウム属の一種(*Penicillium spp.*)、ペトリエリジウム属の一種(*Petriellidium spp*)、*P. メイディス*(*P. maydis*)、*P. フィリピンシス*(*P. philippinensis*)および*P. ソルギ*(*P. sorghi*)を含むペロノスクレロスポラ属の一種(*Peronosclerospora spp.*)、ペロノスポラ属の一種(*Peronospora spp*)、コムギふ枯病菌(*Phaeosphaeria nodorum*)、ファコプソラパチリジ(*Phakopsora pachyrhizi*)、フェリヌスイグニアルス(*Phellinus igniarius*)、フィアロフォラ属の一種(*Phialophora spp*)、フォーマ属の一種(*Phoma spp*)、ホモプシスピティコーラ(*Phomopsis viticola*)、*P. インフェスタンス*(*P. infestans*)を含むフィトフトラ属の一種(*Phytophthora spp.*)、*P. ハルステジイ*(*P. halstedii*)、*P. ビチコラ*(*P. viticola*)を含むプラスモパラ属の一種(*Plasmopara spp.*)、プレオスポラ属の一種(*Pleospora spp.*)、リングうどんこ病菌(*P. leucotricha*)を含むポドスファエラ属の一種(*Podosphaera spp.*)、ポリミキサグラミニス(*Polymyxa graminis*)、ポリミキサベタエ(*Polymyxa betae*)、シュードセルコスボレラヘルボトリコイド(*Pseudocercospora herpotrichoides*)、シュードモナス属の一種(*Pseudomonas spp*)、*P. クベンシス*(*P. cubensis*)、*P. フムリ*(*P. humuli*)を含むシュードペロノスポラ属の一種(*Pseudoperonospora spp.*)、シュードペジザトラケイフィラ(*Pseudopeziza tracheiphila*)、*P. ホルデイ*(*P. hordei*)、*P. レコンディタ*(*P. recondita*)、*P. ストリイホルミス*(*P. striiformis*)、*P. トリチシナ*(*P. trititina*)を含むプッシニア属の一種(*Puccinia spp.*)、ピレノペジザ属の一種(*Pyrenopeziza spp*)、ピレノフォラ属の一種(*Pyrenophora spp*)、イネいもち病菌(*P. oryzae*)を含むピリクラリア属の一種(*Pyricularia spp.*)、*P. ウルチムム*(*P. ultimum*)を含むピシウム属の一種(*Pythium spp.*)、ラムラリア属の一種(*Ramularia spp*)、リゾクトニア属の一種(*Rhizoctonia spp*)、リゾムコールプシルス(*Rhizomucor pusillus*)、リゾプスアリズス(*Rhizopus arrhizus*)、リンコスポリウム属の一種(*Rhynchosporium spp*)、*S. アピオスペルムム*(*S. apiospermum*)および*S. プロリフィカンス*(*S. proliferans*)を含むセドスポリウム属の一種(*Scedosporium spp.*)、スキゾチリウムポミ(*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニア属の一種(*Sclerotinia spp*)、スクレロチウム属の一種(*Sclerotium spp*)、*S. ノドルム*(*S. nodorum*)、*S. トリテイシ*(*S. tritici*)を含むセプトリア属の一種(*Septoria spp*)、スファエロテカマクラリス(*Sphaerotheca macularis*)、スファエロテカフスカ(*Sphaerotheca fusca*) (スファエロテカフリギネア(*Sphaerotheca fuliginea*))、スボロトリクス属の一種(*S*

porothorix spp)、スタゴノスポラノドルム (*Stagonospora nodorum*)、ステムフィリウム属の一種 (*Stemphylium* spp.)、ステレウムヒルスツム (*Stereum hirsutum*)、タナテホルスクケメリス (*Thanatephorus cucumeris*)、チエラビオプシスバシコラ (*Thielaviopsis basicola*)、チレチア属の一種 (*Tilletia* spp)、T. ハルジアヌム (*T. harzianum*)、T. シュードコニンギイ (*T. pseudokoningii*)、T. ヴィリデ (*T. viride*) を含むトリコデルマ属の一種 (*Trichoderma* spp.)、

トリコフィトン属の一種 (*Trichophyton* spp)、チフラ属の一種 (*Typhula* spp)、ウンシヌラネカトル (*Uncinula necator*)、ウロシスチス (*Urocystis* spp)、ウスチラゴ属の一種 (*Ustilago* spp)、V. イナエクアリス (*V. inaequalis*) を含むベンチュリア属の一種 (*Venturia* spp.)、ベルチシリウム属の一種 (*Verticillium* spp) およびキサントモナス属の一種 (*Xanthomonas* spp)。

【0192】

特に、これらを含む式 I の化合物および殺菌・殺カビ組成物を用いて、担子菌綱 (*Basidiomycete*)、子囊菌綱 (*Ascomycete*)、卵菌綱 (*Oomycete*) および / または不完全菌類、ブラソクラディオマイセート (*Blasocladiomycete*)、ツボカビ綱 (*Chytridiomycete*)、グロムス門 (*Glomeromycete*) および / またはケカビ綱 (*Mucoromycete*) における広範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害を防除し得る。

【0193】

これらの病原体としては以下が挙げられ得る。

卵菌綱 (*Oomycete*) であって、以下を含む。フィトフトラカプシシ (*Phytophthora capsici*)、フィトフトラインフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、フィトフトラソヤエ (*Phytophthora sojae*)、フィトフトラフラガリエ (*Phytophthora fragariae*)、フィトフトラニコチアナエ (*Phytophthora nicotianae*)、フィトフトラシンナモミ (*Phytophthora cinnamomi*)、フィトフトラシトリコラ (*Phytophthora citricola*)、フィトフトラシトロフトラ (*Phytophthora citrophthora*) およびフィトフトラエリトロセプチカ (*Phytophthora erythroseptica*) によって引き起こされるものなどのフィトフトラ (*Phytophthora*) 病害；ピシウムアファニデルマツム (*Pythium aphanidermatum*)、ピシウムアレノマネス (*Pythium arrhenomanes*)、ピシウムグラミニコラ (*Pythium graminicola*)、ピシウムイレグラレ (*Pythium irregulare*) およびピシウムウルチマム (*Pythium ultimum*) によって引き起こされるものなどのピシウム (*Pythium*) 病害；ペロノスポラデストラクタ (*Peronospora destructor*)、ペロノスポラパラシティカ (*Peronospora parasitica*)、プラズモパラピチコーラ (*Plasmopara viticola*)、プラズモパラハルステジイ (*Plasmopara halstedii*)、シュードペロノスポラクベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*)、アルブゴカンジダ (*Albugo candida*)、スクレログトラマクロスポラ (*Sclerophthora macrospora*) およびブレミアラクツカエ (*Bremia lactucae*) などのツユカビ目 (*Peronosporales*) によって引き起こされる病害；ならびに、アファノミセスコクリオイデス (*Aphanomyces cochlioides*)、ラビリンツラゾステラエ (*Labyrinthula zosteriae*)、ペロノスクレロスポラソルギ (*Peronosclerospora sorghi*) およびスクレロスポラグラミニコラ (*Sclerospora graminicola*) などの他のもの。

10

20

30

40

50

【0194】

子囊菌綱 (Ascomycetes) であって、例えば、ステムフィリウムソラニ (*Stemphylium solani*)、スタゴノスポラタイナネンシス (*Stagonospora tainanensis*)、スピロカエアオレアギネア (*Spilocaea oleaginea*)、セトスファエリアツルシカ (*Setosphaeria turcica*)、ピレノカエタリコペリシチ (*Pyrenochaeta lycoperisici*)、プレオスポラヘルバルム (*Pleospora herbarum*)、
 フォマデストルクティバ (*Phoma destructiva*)、ファエオスファエリアヘルボトリコイデス (*Phaeosphaeria herpotrichoides*)、ファエオクリプトクスガエウマンニイ (*Phaeocryptococcus gaeumannii*)、
 オフィオスファエレラグラミニコラ (*Ophiosphaerella graminicola*)、オフィボルスグラミニス (*Ophiobolus graminis*)、レプトスファエリアマクランス (*Leptosphaeria maculans*)、ヘンデルソニアクレベリマ (*Hendersonia creberrima*)、ヘルミントスポリウムトリティシレペンティス (*Helminthosporium tritici repentis*)、セトスファエリアツルシカ (*Setosphaeria turcica*)、
 ドレックスレラグリシネス (*Drechslera glycines*)、ジディメラブリオニエ (*Didymella bryoniae*)、シクロコニウムオレアギネウム (*Cycloconium oleagineum*)、コリネスポラカッシコラ (*Corynespora cassiicola*)、コクリオボルスサチブス (*Cochliobolus sativus*)、
 ビポラリスカクティボラ (*Bipolaris cactivora*)、リンゴ黒星病菌 (*Venturia inaequalis*)、ピレノホラテレス (*Pyrenophora teres*)、コムギ黄斑病菌 (*Pyrenophora tritici-repentis*)、アルテルナリアアルテナタ (*Alternaria alternata*)、アルテルナリアブラッシシコラ (*Alternaria brassicicola*)、アルテルナリアソラニ (*Alternaria solani*) およびアルテルナリアトマトフィラ (*Alternaria tomatophila*) などのプレオスポラ目 (Pleosporales) ; セプトリアトリティシ (*Septoria tritici*)、セプトリアノドルム (*Septoria nodorum*)、セプトリアグリシネス (*Septoria glycines*)、セルコスポラアラキディコーラ (*Cercospora rachidicola*)、セルコスポラソジナ (*Cercospora sojae*)、セルコスポラセアエマイデイス (*Cercospora zeae-maydis*)、セルコスポレラカプセラエ (*Cercospora capsellae*) およびセルコスポレラヘルボトリコイデス (*Cercospora herpotrichoides*) などのカブノディウム目 (Capnodiales) ; クラドスポリウムカルポフィルム (*Cladosporium carpophilum*)、クラドスポリウムエフスム (*Cladosporium effusum*)、
 パッサロラフルバ (*Passalora fulva*)、クラドスポリウムオキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*)、
 ドチストロマッセプトスポルム (*Dothistroma septosporum*)、イサリオプシスクラビスポラ (*Isariopsis clavisporea*)、マイコスファエレラフィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*)、コムギ葉枯病菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、マイコベロシエラコエブケイイ (*Mycovellosiella koepkei*)、ファエオイサリオプシスバタチコラ (*Phaeoisariopsis bataticola*)、シュードセルコスポラビチス (*Pseudocercospora vitis*)、シュードセルコスポレラヘルボトリコイド (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、ラムラリアベチコラ (*Ramularia beticola*)、ラムラリアコロシグニ (*Ramularia collo-cygni*)

、ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*)、
 マグナポルテグリセア (*Magnaporthe grisea*)、イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) などのマグナポルテ目 (*Magnaporthales*) ; アニソグラマアノマラ (*Anisogramma anomala*)、アピオ
 グノモニアエラブнда (*Apiognomonina errabunda*)、サイトスボ
 ラプラタニ (*Cytospora platani*)、ジアポルテファセオロルム (*Diaportha phaseolorum*)、ディスクラDESTルクティバ (*Discula destructiva*)、グノモニアフルクティコーラ (*Gnomonia fructicola*)、
 グリネリアウビコーラ (*Greeneria uvicola*) 10
 、メランコニウムジュグランディヌム (*Melanconium juglandinum*)、ホモプシスビティコーラ (*Phomopsis viticola*)、シロコッカ
 スクラビギグネンティ - ジュグランダセアラム (*Sirococcus claviginenti-juglandacearum*)、ツバキアドリイナ (*Tubakia dryina*)、
 ディカルペラ属の一種 (*Dicarpella spp.*)、バルサセラトスペルマ (*Valsa ceratosperma*) などのジアポルテ目 (*Diaporthales*) ;
 ならびに、アクチノチリウムグラミニス (*Actinothyrium graminis*)、アスコキタピシ (*Ascochyta pisi*)、アスペルギルスフラブス (*Aspergillus flavus*)、アスペルギルスフミガー
 ツス (*Aspergillus fumigatus*)、アスペルギルスニズランス (*Aspergillus nidulans*)、アスペリスポリウムカリカエ (*Asperisporium caricae*)、ブルメリエラジャアピイ (*Blumeriella jaapii*)、
 カンジダ属の一種 (*Candida spp.*)、カブノジウムラ
 モスム (*Capnodium ramosum*)、セファロアスクス属の一種 (*Cephaloascus spp.*)、セファロスポリウムグラミネウム (*Cephalosporium gramineum*)、セラトシステイスパラドクサ (*Ceratocystis paradoxa*)、
 キトミウム属の一種 (*Chaetomium spp.*) 20
 、ヒメノシフスシュードアルビツス (*Hymenoscyphus pseudoalbidus*)、コッシディオイデス属の一種 (*Coccidioides spp.*)、シリンドロスポリウムパディ (*Cylindrosporium padi*)、ジプロカル
 ポンマラエ (*Diplocarpon malae*)、ドレパノベジザカンペストリス (*Drepanopeziza campestris*)、エルシノエアンペリナ (*Elsinoe ampelina*)、
 エピコッカムニグラム (*Epicoccum nigrum*)、エピデルモフィトン属の
 一種 (*Epidermophyton spp.*)、ユーチパラタ (*Eutypa lata*)、ゲオトリクムカンジズム (*Geotrichum candidum*)、ギベリ
 ナセラリス (*Gibellina cerealis*)、グロエオセルコスボラソルギ
 (*Gloeocercospora sorghi*)、グロエオデスポミゲナ (*Gloeodes pomigena*)、グロエオスポリウムペレナンス (*Gloeosporium perennans*) などの他のものによって引き起こされるものといった汚斑病、
 斑点病、イモチ病または胴枯れ病および / または腐敗病 ; グロエオチニアテムレンタ (*Gloeotinia temulenta*)、グリフォスパエリアコルチコラ (*Griphosphaeria corticola*)、カバチエラリニ (*Kabatella lini*)、
 レプトグラフィウムミクロスボルム (*Leptographium microsporium*)、レプトスファエルリアクラッサスカ (*Leptosphaeria crassiasca*)、ロフォデルミウムセディチオスム (*Lophodermium seditiosum*)、マルソニナグラミニコーラ (*Marssonina graminicola*)、コムギ赤かび病菌 (*Microdochium nivale*)、
 モニリニアフルクティコーラ (*Monilinia fructicola*)、モノグラフエラアルベセンス (*Monographella albescens*)、
 モノスポラスカノンバルス (*Monosporascus cannonball*) 30
 40
 50

lus)、ナエマシクルス属の一種(*Naemacyclus* spp.)、オフィオストマノボウルミ(*Ophiostomanovo-ulmi*)、パラコシジオイデスブラジリエンス(*Paracoccidioides brasiliensis*)、ペニシリウムエクソパンスム(*Penicillium expansum*)、ペスタロチアロドデンドリ(*Pestalotia rhododendri*)、ペトリエリジウム属の一種(*Petriellidium* spp.)、ペジクラ属の一種(*Pezicula* spp.)、フィアロホラグレガタ(*Phialophora gregata*)、フィラコラポミゲナ(*Phyllachora pomigena*)、フィマトトリクムオムニボラ(*Phymatotrichum omnivora*)、フィサロスボラアブディタ(*Physalospora abditata*)、プレクトスפורウムタバシヌム(*Plectosporium tabacinum*)、ポリシタルムプスツランス(*Polyscytalum pustulans*)、シュードベジザメディカギニス(*Pseudopeziza medicaginis*)、ピレノベジザブラッシカエ(*Pyrenopeziza brassicae*)、ラムリスボラソルギ(*Ramulispora sorghi*)、ラウドクリンシュードツガエ(*Rhabdocline pseudotsugae*)、リンコスפורウムセカリス(*Rhynchosporium secalis*)、イネ葉しょう腐敗病菌(*Sacrocladium oryzae*)、スケドスפורウム属の一種(*Scedosporium* spp.)、スキゾチリウムポミ(*Schizothyrium pomi*)、スクレロチニアスクレロティオルム(*Sclerotinia sclerotiorum*)、スクレロチニアミノル(*Sclerotinia minor*)；スクレロチウム属の一種(*Sclerotium* spp.)、チフライシカリエンシス(*Typhula ishikariensis*)、セイマトスפורウムマリエ(*Seimatosporium mariae*)、レプテウチパクプレッシ(*Lepteutypa cupressi*)、セプトシタルボルム(*Septocytaruborum*)、スファセロマペルセー(*Sphaceloma perseae*)、スポロネマファシディオイデス(*Sporonema phacidiodoides*)、スティグミナパルミボラ(*Stigminalpalmivora*)、タペシアヤルンデ(*Tapesiayallundae*)、タフリナブラタ(*Taphrinabullata*)、チエビオブシスバシコラ(*Thielviopsis basicola*)、トリコセプトリアグルクチゲナ(*Trichoseptoria fructigena*)、ジゴフィアラジャミセンシス(*Zygophialajamaicensis*)；
 例えばブルメリアグラミニス(*Blumeriagramminis*)、エリシフェポリゴニ(*Erysiphe polygoni*)、ウンシヌラネカトル(*Uncinulanecator*)、スファエロテカフリゲナ(*Sphaerotheca fuligena*)、リンゴうどんこ病菌(*Podosphaera leucotricha*)、ポドスパエラマクラリス(*Podosphaeramacularis*)、ゴロビノマイセスシコラセルム(*Golovinomyces cichoracearum*)、レベイルラタウリカ(*Leveillula taurica*)、マイクロスファエラディフッサ(*Microsphaera diffusa*)、オイディオブシスゴッシピイ(*Oidiopsis gossypii*)、フィラクチニアグッタタ(*Phyllactinia guttata*)およびオイジウムアラキディス(*Oidium arachididis*)などのウドンコカビ目(*Erysiphales*)によって引き起こされるものといったウドンコ病病害；例えばドチオレアラロマチカ(*Dothiorella aromatica*)、ジプロディアセリアタ(*Diplodia seriata*)、ガイグナルディアビドウェリイ(*Guignardia bidwellii*)、ボトリチスシネレア(*Botrytis cinerea*)、ボトリオチニアアリイ(*Botryotinia alli*)、ボトリオチニアファビ(*Botryotinia fabae*)、フシコクムアミグダリ(*Fusicoccum amygdali*)、ラシオジプロディアテオブロマエ(*Lasiodiplodia theobromae*)、マクロフ

10

20

30

40

50

オーマテイコラ (*Macrophoma theicola*)、マクロフォミナファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*)、フィロスティクタククルビタセアルム (*Phyllosticta cucurbitacearum*) などのボトリオスフェリア目 (*Botryosphaerales*) によって引き起こされるものといったかび類；例えばコレトトリカムグロエオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides*)、コレトトリカムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*)、コレトトリカムゴッシピイ (*Colletotrichum gossypii*)、グロメララシングラタ (*Glomerella cingulata*) およびコレトトリカムグラミニコラ (*Colletotrichum graminicola*) などのグロメララレス属 (*Glomerella*) によって引き起こされるものといった炭疽病；ならびに、例えばアクレモニウムストリクツム (*Acremonium strictum*)、クラビセプスプルブレア (*Claviceps purpurea*)、フザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*)、フザリウムグラミネアルム (*Fusarium graminearum*)、フザリウムビルグリホルメ (*Fusarium virguliforme*)、フザリウムオキシスポルム (*Fusarium oxysporum*)、フザリウムスブグルチナンス (*Fusarium subglutinans*)、フザリウムオキシスポルム (*Fusarium oxysporum* f. sp. *cubense*)、ゲルラキアニバレ (*Gerlachia nivale*)、ギベレラフジクroi (*Gibberella fujikuroi*)、ギベレラゼアエ (*Gibberella zeae*)、グリオクラジウム属の一種 (*Gliocladium* spp.)、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*)、ネクトリアラムラライエ (*Nectria ramulariae*)、トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)、トリコテシウムロセウム (*Trichothecium roseum*) およびベルチシリウムテオブロマエ (*Verticillium theobromae*) などの肉座菌目 (*Hypocreales*) によって引き起こされるものといった萎凋病または胴枯れ病。

【0195】

例えばウスチラギノイデアビレンス (*Ustilaginoida virens*)、ウスチラゴヌダ (*Ustilago nuda*)、ウスチラゴトリティシ (*Ustilago tritici*)、ウスチラゴゼアエ (*Ustilago zeae*) などのクロボキン目 (*Ustilaginales*) によって引き起こされるものといった黒穂病菌を含む担子菌綱 (*Basidiomycete*)、例えばセロテリウムフィチ (*Cerotium fici*)、クリソミクサアルクトスタフィリ (*Chrysomyxa arctostaphyli*)、コレオスポリウムイポモエアエ (*Coleosporium ipomoeae*)、ヘミレイアバスタトリクス (*Hemileia vastatrix*)、プッシニアアラキディス (*Puccinia arachidis*)、プッシニアカカバタ (*Puccinia cacabata*)、プッシニアグラミニス (*Puccinia graminis*)、プッシニアレコンディタ (*Puccinia recondita*)、プッシニアソルギ (*Puccinia sorghi*)、プッシニアホルデイ (*Puccinia hordei*)、プッシニアストリイフォルミス (*Puccinia striiformis* f. sp. *Hordei*)、プッシニアストリイフォルミス (*Puccinia striiformis* f. sp. *Secalis*)、プッシニアストルムコリリ (*Puccinia strum coryli*) などのサビキン目 (*Pucciniales*)、または、クロナルチウムリビコラ (*Cronartium ribicola*)、ジムノスポランギウムジュニペリ - ビジニアネ (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、メランブソラメデュサエ (*Melampsora medusae*)、ファコブソラパチリジ (*Phakopsora pachyrhizi*)、フラグミジウムムクロナツム (*Phragmidium mucronatum*)、フィソペラアンペロシディス (*Physopel*

la ampelosis)、トランスケリアディスコロール(*Tranzschelia discolor*)およびウロマイセスビシエ-ファビエ(*Uromyces viciciae-fabae*)などのサビキン目(*Uredinales*)によって引き起こされるものといったサビ病菌;ならびに、クリプトコックス属の一種(*Cryptococcus spp.*)、エクソバシジウムベクスアン(*Exobasidium vexans*)、マラスミエルスイノデルマ(*Marasmiellus inoderma*)、マイセナ属の一種(*Mycena spp.*)、スファセロテカレイリアナ(*Sphacelotheca reiliana*)、チフライシカリエンシス(*Typhula ishikariensis*)、ウロシスチスアグロピリ(*Urocystis agropyri*)、イテルソニアペルプレキサン(*Itersonilia perplexans*)、クルチシウムインビスム(*Corticium invisum*)、ラエチサリアフシホルミス(*Laetisaria fuciiformis*)、ワイテアシルシナタ(*Waitea circinata*)、イネ紋枯病菌(*Rhizoctonia solani*)、テンサイ根腐病菌(*Thanetophorus cucurmeris*)、エンチロマダリアエ(*Entyloma dahliae*)、エンチロメラミクロスポラ(*Entylomella microspora*)、ネオボシアモリニアエ(*Neovossia moliniaae*)およびチレチアカリエス(*Tilletia caries*)によって引き起こされるものなどの他の腐敗病および病害。

【0196】

フィソデルマイデイス(*Physoderma maydis*)などのコウマクノウキン目(*Blastocladiomycetes*)。

【0197】

コアネフォラククリピタルム(*Choanephora cucurbitarum*);ムコール属の一種(*Mucor spp.*);リゾプスアルヒズス(*Rhizopus arrhizus*)などのケカビ綱(*Mucoromycetes*)。

【0198】

ならびに、上記に列挙されているものと近縁の他の種および属によって引き起こされる病害。

【0199】

その殺菌・殺カビ活性に追加して、化合物およびこれらを含む組成物はまた、エルウィニアアミロボラ(*Erwinia amylovora*)、エルウィニアカラトボラ(*Erwinia caratovora*)、キサントモナスカムペストリス(*Xanthomonas campestris*)、シュードモナスシリंगाエ(*Pseudomonas syringae*)、ストルプトマイセススカビイス(*Strptomyces scabies*)などのバクテリアおよび他の関連する種、ならびに、一定の原生動物に対する活性を有し得る。

【0200】

本発明の範囲内においては、保護されるべき標的作物および/または有用な植物は、典型的には、例えばブラックベリー、ブルーベリー、クランベリー、ラズベリーおよびイチゴといった液果植物;例えばオオムギ、トウモロコシ(コーン)、キビ、カラスムギ、イネ、ライ麦、モロコシ属(*sorghum*)ライコムギおよびコムギといった穀類;例えば綿、亜麻、アサ、ジュートおよびサイザルといった繊維植物;例えば糖質および飼料ビート、コーヒー、ホップ、マスタード、アブラナ(カノーラ)、ケシ、サトウキビ、ヒマワリ、チャおよびタバコといった農作物;例えばリンゴ、アンズ、アボカド、バナナ、サクランボ、柑橘類、ネクタリン、モモ、セイヨウナシおよびセイヨウスモモといった果樹;例えばパミュダグラス、イチゴツナギ、ベントグラス、センチピードグラス、ウシノケグサ、ライグラス、アメリカシバおよびノシバといった草;バジル、ルリジサ、チャイブ、コリアンダー、ラベンダー、ラベージ、ミント、オレガノ、パセリ、ローズマリー、セージおよびタイムなどのハーブ;例えばインゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメおよびダイズ、インゲンマメといったマメ科植物;例えばアーモンド、カシュー、落花生、へ

ーゼルナッツ、ピーナッツ、ペカン、ピスタチオおよびクルミといった堅果；例えばアブラヤシといったヤシ；例えば花、低木および高木といった観賞用植物；例えばカカオ、ココナツ、オリーブおよびゴムといった他の高木；例えばアスパラガス、ナス、ブロッコリ、キャベツ、ニンジン、キュウリ、ニンニク、レタス、ペポカボチャ、メロン、オクラ、タマネギ、コショウ、ジャガイモ、カボチャ、ダイオウ、ハウレンソウおよびトマトといった野菜；ならびに、例えばブドウといったつる植物などの多年生および1年生作物を含む。

【0201】

本発明に係る有用な植物および/または標的作物は、例えば、昆虫抵抗性（例えばBt、およびVIP品種）ならびに病害抵抗性、除草剤耐性（商品名Roundup Ready（登録商標）およびLiberty Link（登録商標）で市販されている例えばグリホサート - およびグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種）および線虫抵抗性品種などの従来の品種、ならびに、遺伝子的に強化または遺伝子操作された品種を含む。一例として、好適に遺伝子的に強化または遺伝子操作された品種は、Stoneville 5599 BR綿およびStoneville 4892 BR綿品種を含む。

10

【0202】

「有用な植物」および/または「標的作物」という用語は、従来の交配または遺伝子操作方法によって、プロモキシニルのような除草剤、または、ある分類の除草剤（例えば、HPD抑制剤、ALS抑制剤、例えばプリミスルフロン、プロスルフロンおよびトリフロキシスルフロン、EPSPS（5 - エノール - ピロピル - シキメート - 3 - リン酸塩 - シンターゼ）抑制剤、GS（グルタミンシンターゼ）抑制剤またはPPO（プロトポルフィリノーゲン - オキシダーゼ）抑制剤など）に対する耐性がもたらされた有用な植物をも含むと理解されるべきである。従来の交配方法（突然変異誘発）によって、例えばイマザモックスといったイミダゾリノンに対する耐性がもたらされた作物の一例は、Clearfield（登録商標）夏ナタネ（カノーラ）である。遺伝子操作方法によって除草剤またはあるクラスの除草剤に対する耐性がもたらされた作物の例としては、商品名Roundup Ready（登録商標）、Herculex I（登録商標）およびLiberty Link（登録商標）で市販されているグリホサート - およびグルホシネート - 耐性トウモロコシ品種が挙げられる。

20

【0203】

「有用な植物」および/または「標的作物」という用語は、自然発生的なもの、または、有害な昆虫に対する抵抗性が与えられたものを含むと理解されるべきである。これは、トキシン - 産生バクテリア由来として公知であるものなどの1種以上の選択的に作用するトキシンの合成能を例えば有するよう、組換えDNA技術を用いることで形質転換された植物を含む。発現されることが可能であるトキシンの例としては、 δ - エンドトキシン、栄養型殺虫性タンパク質（Vip）、線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質、ならびに、サソリ、蛛形類、大型のハチ（wasp）および真菌によって産生されるトキシンが挙げられる。パチルスチューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）トキシンを発現するよう変性された作物の一例は、BtトウモロコシKnockOut（登録商標）（Syngenta Seeds）である。殺虫性耐性をコードする2種以上の遺伝子を含み、それ故、2種以上のトキシンを発現する作物の一例は、VipCot（登録商標）（Syngenta Seeds）である。作物またはその種子材料もまた、複数種の有害生物に対して耐性であることが可能である（いわゆる、遺伝子修飾により形成される場合の重畳的なトランスジェニックイベント）。例えば、植物は、例えばHerculex I（登録商標）（Dow AgroSciences, Pioneer Hi - Bred International）のように除草剤耐性であると同時に、殺虫性タンパク質の発現能を有していることが可能である。

30

40

【0204】

用語「有用な植物」および/または「標的作物」は、例えば、いわゆる「感染特異的タンパク質」（PRP、例えば欧州特許出願公開第0 392 225号明細書を参照のこ

50

と)などの選択的な作用を有する抗病原性物質を合成することが可能であるよう組換えDNA技術を用いて形質転換された有用な植物をも含むと理解されるべきである。このような抗病原性物質およびこのような抗病原性物質を合成可能である形質転換植物の例は、例えば、欧州特許出願公開第0 392 225号明細書、国際公開第95/33818号パンフレットおよび欧州特許出願公開第0 353 191号明細書から公知である。このような形質転換植物を製造する方法は一般に当業者に公知であると共に、例えば、上記の公報に記載されている。

【0205】

形質転換植物によって発現されることが可能であるトキシンとしては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) またはバチルスポピリア (*Bacillus popilliae*) 由来の殺虫性タンパク質; または、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エンドトキシンなどのバチルスチューリングシス (*Bacillus thuringiensis*) 由来の殺虫性タンパク質、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (Vip); または、フォトラバダスルミネセンス (*Photobacterium luminescens*)、ゼノラバダスネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などの、例えばフォトラバダス属の一種 (*Photobacterium spp.*) もしくはゼノラバダス属の一種 (*Xenorhabdus spp.*) といった線虫共生バクテリアの殺虫性タンパク質; サソリトキシン、クモトキシン、大型のハチ (wasp) トキシンおよび他の昆虫特異的神経トキシンなどの動物によって生成されるトキシン; ストレプトミセス (*Streptomyces*) トキシンなどの真菌によって生成されるトキシン、エンドウマメレクチン、オオムギレクチンまたはマツユキソウレクチンなどの植物レクチン; アグルチニン; トリプシン抑制剤、セリタンパク分解酵素抑制剤、パタチン、シスタチン、パパイン抑制剤などのプロテイナーゼ抑制剤; リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サボリンまたはブリオジンなどのリボソーム - 不活性化タンパク質 (RIP); 3 - ヒドロキシステロイドキシダーゼ、エクジステロイド - UDP - グリコシル - トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン抑制剤、HMG - COA - レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムまたはカルシウム遮断剤などのイオンチャネル遮断剤、幼虫ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。

【0206】

さらに、本発明の文脈においては、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cといった - エンドトキシン、または、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3Aといった栄養型殺虫性タンパク質 (Vip) とは、特にハイブリッドトキシン、切断型トキシンおよび修飾トキシンでもあることが理解されるべきである。ハイブリッドトキシンは、これらのタンパク質の異なるドメインの新たな組み合わせによって組換えで生成される (例えば、国際公開第02/15701号パンフレットを参照のこと)。例えば切断型Cry1Abといった切断型トキシンが公知である。修飾トキシンの場合、天然トキシンの1種以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換において、好ましくは自然に存在しないタンパク分解酵素認識配列がトキシンに挿入され、例えば、Cry3A055の場合には、カテプシン - G - 認識配列がCry3Aトキシンに挿入される (国際公開第03/018810号パンフレットを参照のこと)。

【0207】

このようなトキシン、または、このようなトキシンを合成可能な形質転換植物のさらなる例が、例えば、欧州特許出願公開第A - 0 374 753号明細書、国際公開第93/07278号パンフレット、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第A - 0 427 529号明細書、欧州特許出願公開第A - 451 878号明

細書および国際公開第03/052073号パンフレットに開示されている。

【0208】

このような形質転換植物の調製プロセスは一般に当業者に公知であり、例えば、上記の刊行物において記載されている。Cry I - タイプデオキシリボ核酸およびその調製は、例えば、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第A-0367474号明細書、欧州特許出願公開第A-0401979号明細書および国際公開第90/13651号パンフレットから公知である。

【0209】

形質転換植物に含有されるトキシンは、有害な昆虫に対する耐性を植物に付与する。このような昆虫は昆虫の分類群のいずれかのものであることが可能であるが、特に、甲虫（鞘翅目）、双翅昆虫（双翅目）および蝶（鱗翅目）に通例見出される。

10

【0210】

殺虫耐性をコードし、1種以上のトキシンを発現する1種以上の遺伝子を含む形質転換植物は公知であり、そのいくつかは市販されている。このような植物の例は：Yield Gard（登録商標）（Cry 1Abトキシンを発現するトウモロコシ品種）；Yield Gard Root worm（登録商標）（Cry 3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Yield Gard Plus（登録商標）（Cry 1AbおよびCry 3Bb1トキシンを発現するトウモロコシ品種）；Starlink（登録商標）（Cry 9Cトキシンを発現するトウモロコシ品種）；Herculex I（登録商標）（Cry 1Fa2トキシンおよび酵素ホスフィトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ（PAT）を発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成されているトウモロコシ品種）；NuCOTN 33B（登録商標）（Cry 1Acトキシンを発現する綿品種）；Bollgard I（登録商標）（Cry 1Acトキシンを発現する綿品種）；Bollgard II（登録商標）（Cry 1AcおよびCry 2Abトキシンを発現する綿品種）；VipCot（登録商標）（Vip3AおよびCry 1Abトキシンを発現する綿品種）；NewLeaf（登録商標）（Cry 3Atキシンを発現するジャガイモ品種）；NatureGard（登録商標）、Agrisure（登録商標）GT Advantage（GA21グリホサート-耐性形質）、Agrisure（登録商標）CB Advantage（Bt11コーン穿孔性害虫（CB）形質）およびProtecta（登録商標）である。

20

30

【0211】

このような形質転換作物のさらなる例は以下のとおりである。

1. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製 Bt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断型Cry 1Abトキシンのトランスジェニック発現により、アワノメイガ（ヨーロッパアワノメイガ（*Ostrinia nubilalis*）およびセサミアノナグリオイデス（*Sesamia nonagrioides*））に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ（*Zea mays*）。Bt11トウモロコシはまた、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

40

【0212】

2. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France 製 Bt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry 1Abトキシンのトランスジェニック発現によって、アワノメイガ（ヨーロッパアワノメイガ（*Ostrinia nubilalis*）およびセサミアノナグリオイデス（*Sesamia nonagrioides*））に対する耐性が付与された遺伝子操作されたトウモロコシ（*Zea mays*）。Bt176トウモロコシはまた、酵素PATをトランスジェニック発現して除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成している。

【0213】

50

3. Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France 製 MIR604 トウモロコシ、登録番号 C/FR/96/05/10。修飾 Cry3A トキシンのトランスジェニック発現により昆虫耐性が付与されたトウモロコシ。このトキシンは、カテプシン-G-タンパク分解酵素認識配列の挿入により修飾された Cry3A055 である。このような形質転換トウモロコシ植物の調製は、国際公開第 03/018810 号パンフレットに記載されている。

【0214】

4. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 MON863 トウモロコシ、登録番号 C/DE/02/9。MON863 は、Cry3Bb1 トキシンを発現し、一定の鞘翅目昆虫に対する耐性を有する。

10

【0215】

5. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 IPC531 綿、登録番号 C/ES/96/02。

【0216】

6. Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium 製 1507 トウモロコシ、登録番号 C/NL/00/10。一定の鱗翅目昆虫に対する耐性を達成するタンパク質 Cry1F の発現、および、除草剤 グルホシネートアンモニウムに対する耐性を達成するための PAT タンパク質の発現のために遺伝子操作されたトウモロコシ。

20

【0217】

7. Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium 製 NK603 x MON810 トウモロコシ、登録番号 C/GB/02/M3/03。遺伝子操作品種 NK603 および MON810 を交配させることによる従来交配型ハイブリッドトウモロコシ品種からなる。NK603 x MON810 トウモロコシは、アグロバクテリウム属の一種 (Agrobacterium sp.) の菌株 CP4 から得られるタンパク質 CP4 EPSPS をトランスジェニック発現し、これにより、除草剤 Roundup (登録商標) (グリホサートを含む) に対する耐性が付与され、また、バチルスチューリングェンシス (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) から得られる Cry1Ab トキシンをトランスジェニック発現し、これにより、アワノメイガを含む一定の鱗翅目に対する耐性がもたらされる。

30

【0218】

本明細書において用いられるところ、「生息地」という用語は、植物が成長している圃場、または、栽培されている植物の種子が播種された圃場、または、種子が土壤に蒔かれることとなる圃場を意味する。これは、土壤、種子および実生、ならびに、確立した植生を含む。

【0219】

「植物」という用語は、種子、実生、苗、根、塊茎、茎、柄、群葉および果実を含む植物のすべての物理的な部分を指す。

40

【0220】

「植物繁殖体」という用語は、その増殖に用いられることが可能である種子などの植物の生殖部、および、挿し木もしくは例えばジャガイモといった塊茎などの栄養体を表すと理解される。例えば種子 (厳密な意味で)、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎および植物の部分が挙げられ得る。発芽後もしくは土壤から出芽した後に移植されることとなる発芽した植物および若芽もまた挙げられる。これらの若芽は、移植前に浸漬による完全または部分的な処置によって保護されてもよい。好ましくは、「植物繁殖体」は種子を表すと理解される。

50

【0221】

慣用名を用いて本明細書において言及される有害生物防除剤は、例えば、“The Pesticide Manual”, 15th Ed., British Crop Protection Council 2009から公知である。

【0222】

式Iの化合物は、そのままの形態で、または、好ましくは、配合技術分野において簡便に採用される補助剤と一緒に用いられ得る。この目的のためにこれらは、公知の様式で、乳化性濃縮物、コーティング用ペースト、直接噴射可能もしくは希釈可能な溶液または懸濁液、希釈エマルジョン、水和剤、可溶性粉末、粉剤、粒質物、および、例えば高分子物質中のカプセルに簡便に配合され得る。組成物のタイプと同様に、吹付け、霧吹き、散粉、散布、コーティングまたは掛け流しなどの適用方法が、意図される目的およびその時点での状況に応じて選択される。組成物はまた、安定化剤、消泡剤、粘度調節剤、バインダまたは粘着剤、ならびに、肥料、微量元素の供給源、または、特別な効果を得るための他の配合物などのさらなる補助剤を含有していてもよい。

10

【0223】

例えば農業に用いられる好適なキャリアおよび補助剤は、固体または液体であることが可能であり、配合技術において有用な物質であり、例えば天然もしくは再生ミネラル物質、溶剤、分散剤、湿潤剤、粘着剤、増粘剤、バインダまたは肥料である。このようなキャリアは、例えば国際公開第97/33890号パンフレットに記載されている。

【0224】

懸濁液濃縮物は、活性な化合物の微細な固体粒子が懸濁した水性配合物である。このような配合物は沈降防止剤および分散剤を含むと共に、活性を高めるために湿潤剤、ならびに、消泡剤および結晶成長抑制剤をさらに含み得る。使用においては、これらの濃縮物は水中で希釈され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性処方成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

20

【0225】

水和剤は、水または他の液体キャリア中に容易に分散する微細粒子の形態である。これらの粒子は、固体マトリックスに保持された活性処方成分を含有する。典型的な固体マトリックスとしては、フーラー土、カオリンクレイ、シリカおよび他の易湿性の有機もしくは無機固形分が挙げられる。水和剤は通常、5%~95%の活性処方成分と少量の湿潤剤、分散剤または乳化剤とを含有する。

30

【0226】

乳化性濃縮物は水または他の液体中に分散性である均質な液体組成物であって、活性な化合物と液体もしくは固体乳化剤とからのみ構成されていてもよく、または、キシレン、高沸点芳香族ナフサ、イソホロンおよび他の不揮発性有機溶剤などの液体キャリアを含有していてもよい。使用においては、これらの濃縮物は水または他の液体中に分散され、通常は処理されるべき領域にスプレーで適用される。活性処方成分の量は濃縮物の0.5%~95%の範囲内であり得る。

【0227】

粒状配合物は押出物および比較的粗大な粒子の両方を含み、通常は、処理が必要とされる領域に希釈されることなく適用される。粒状配合物に係る典型的なキャリアとしては、活性な化合物を吸収するか活性な化合物でコーティング可能である、砂、フーラー土、アタパルジャイトクレイ、ベントナイトクレイ、モンモリロナイトクレイ、パーミキュライト、パーライト、炭酸カルシウム、れんが、軽石、葉ろう石、カオリン、ドロマイト、焼き石膏、木粉、粉碎したトウモロコシ穂軸、粉碎したピーナッツの外殻、砂糖、塩化ナトリウム、硫酸ナトリウム、ナトリウムケイ酸、ホウ酸ナトリウム、マグネシア、雲母、酸化鉄、酸化亜鉛、酸化チタン、酸化アンチモン、氷晶石、石膏、珪藻土、硫酸カルシウムおよび他の有機もしくは無機材料が挙げられる。粒状配合物は通常5%~25%の活性処方成分を含有し、これは、高沸点芳香族ナフサ、ケロシンおよび他の石油留分などの表面活性剤、もしくは、植物油；ならびに/または、デキストリン、膠もしくは合成樹脂など

40

50

の展着剤を含んでいてもよい。

【0228】

粉剤は、活性処方成分と、分散剤およびキャリアとして作用するタルク、クレイ、粉末ならびに他の有機および無機固形分などの微細固形分との易流動性の混和物である。

【0229】

マイクロカプセルは、典型的には、内包された材料を制御された速度で周囲に放出させることが可能である不活性の多孔性シェルに内包された活性処方成分の小滴または顆粒である。カプセル化された小滴は、直径が典型的には1～50ミクロンである。内包された液体は典型的には、カプセルの重量の50～95%を構成し、活性な化合物に追加して溶剤を含んでいてもよい。カプセル化された顆粒は一般に、顆粒の孔部開口をシールして、液体形態の活性種を顆粒の孔部に保持する多孔性メンブランを有する多孔性顆粒である。顆粒は典型的には、直径が1ミリメートル～1センチメートル、好ましくは1～2ミリメートルの範囲内である。顆粒は、押し出し成形、凝塊もしくはブリルによって形成されるか、または、天然のものである。このような材料の例は、パーミキュライト、焼成クレイ、カオリン、アタパルジャイトクレイ、おがくずおよび粒状炭素である。シェルまたはメンブラン材料は、天然および合成ゴム、セルロース系材料、スチレン-ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタンおよびデンブンザンデートを含む。

10

【0230】

農芸化学用途に係る他の有用な配合物は、アセトン、アルキル化ナフタレン、キシレンおよび他の有機溶剤などの、所望の濃度での完全な溶解が達成される溶剤中における活性処方成分の単なる溶液を含む。低沸点分散剤溶剤キャリアの蒸発に伴って活性処方成分が微細に分離された形態に散布される加圧散布機もまた用いられ得る。

20

【0231】

上記の配合物タイプの本発明の組成物の配合に有用である好適な農業用補助剤およびキャリアは、当業者に周知である。

【0232】

利用可能である液体キャリアとしては、例えば、水、トルエン、キシレン、石油ナフサ油、作物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、無水酢酸、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、クロロベンゼン、シクロヘキサノール、アルキル酢酸塩、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアビエート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサソラン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール、アルキルピロリジノン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、ピネン、d-リモネン、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、-ブチロラクトン、グリセロール、グリセロール二酢酸、グリセロール酢酸、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシ-プロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、クタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール(PEG400)、プロピオン酸、プロピレングリコール、プロピレングリコールモノメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、メタノール、エタノール

30

40

50

ール、イソプロパノール、および、アミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール等などの高分子量アルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセリンおよびN - メチル - 2 - ピロリジノンが挙げられる。濃縮物の希釈には、水が一般的に選択されるキャリアである。

【0233】

好適な固体キャリアとしては、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、アタパルジャイトクレイ、キースラガー、チョーク、珪藻土、石灰、炭酸カルシウム、ベントナイトクレイ、フーラー土、綿実の外殻、小麦粉、ダイズ粉、軽石、木粉、クルミの外殻粉およびリグニンが挙げられる。

【0234】

幅広い範囲の表面活性剤が、特に適用前にキャリアで希釈されるよう設計されたものといった、前記液体および固体組成物の両方において有利に利用される。これらの表面活性剤は通常、使用される際、0.1% ~ 15重量%の配合物を含む。これらはアニオン性、カチオン性、ノニオン性または高分子特性であることが可能であり、乳化剤、湿潤剤、懸濁剤として、または、他の目的のために利用されることが可能である。典型的な表面活性剤としては、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどのアルキル硫酸塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアールスルホネート塩；ノニルフェノール - C . s u b . 1 8 エトキシレートなどのアルキルフェノール - アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコール - C . s u b . 1 6 エトキシレートなどのアルコール - アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹸；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレンスルホン酸塩；ジ(2 - エチルヘキシル)スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレエートなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第4級アミン；ステアリン酸ポリエチレングリコールなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびに、モノおよびジアルキルリン酸エステルの塩が挙げられる。

【0235】

農業用組成物において通例利用される他の補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度変性剤、懸濁剤、噴霧粒調節剤、顔料、酸化防止剤、発泡剤、消泡剤、遮光剤、相溶化剤、消泡剤、金属イオン封鎖剤、中和剤および緩衝剤、腐食抑制剤、染料、臭気剤、展着剤、浸透補助剤、微量元素、緩和剤、潤滑剤および固着剤が挙げられる。

【0236】

さらに加えて、他の殺生性活性処方成分または組成物を、本発明の組成物と組み合わせ、本発明の方法において用い、および、本発明の組成物と同時にまたは順次に適用してもよい。同時に適用する場合、これらのさらなる活性処方成分は、本発明の組成物と一緒に配合されても、または、例えば、噴霧タンク中で一緒に混合されてもよい。これらのさらなる殺生性活性処方成分は、殺菌・殺カビ剤、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤および/または植物成長調節剤であり得る。

【0237】

加えて、本発明の組成物はまた、1種以上の全身獲得抵抗性誘導物質(「SAR」誘導物質)と一緒に適用され得る。SAR誘導物質は公知であって、例えば米国特許第6,919,298号明細書に記載されており、例えば、サリチル酸塩および市販されているSAR誘導物質であるアシベンゾラル - S - メチルが挙げられる。

【0238】

式Iの化合物は通常組成物の形態で用いられ、処理されるべき作物領域または植物に、さらなる化合物と同時に、または、順次に適用されることが可能である。これらのさらなる化合物は、例えば肥料もしくは微量元素供与物、または、植物の成長に影響を及ぼす他の調製物であることが可能である。これらはまた、選択的な除草剤もしくは非選択的な除草剤、ならびに、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、殺菌剤、殺線虫剤、軟体動物駆除剤であることが可能であり、または、これらの調製物の数種の混合物であって、所望の場合には配合

10

20

30

40

50

物の分野において慣例的に利用されるさらなるキャリア、界面活性剤もしくは適用促進補助剤を伴う混合物であることが可能である。

【0239】

式 I の化合物は、活性処方成分として少なくとも 1 種の式 I の化合物を含む、植物病原性微生物に対する防除もしくは保護のための（殺菌・殺カビ）組成物の形態で用いられ得、または、遊離形態もしくは農芸化学的に使用可能な塩形態の上記に定義されている少なくとも 1 種の好ましい個別の化合物と、上記の補助剤の少なくとも 1 種との形態で用いられ得る。

【0240】

本発明は従って、少なくとも 1 種の式 I の化合物、農学的に許容可能なキャリア、および、任意選択により補助剤を含む、組成物、好ましくは殺菌・殺カビ組成物を提供する。農学的に許容可能なキャリアは、例えば農業用途に好適なキャリアである。農業用キャリアは技術分野において周知である。好ましくは、前記組成物は、式 I の化合物に追加して、少なくとも 1 種以上の有害生物防除的に活性な化合物、例えば追加の殺菌・殺カビ活性処方成分を含んでいてもよい。

10

【0241】

式 (I) の化合物は、組成物における唯一の活性処方成分であってもよく、また、適切な場合、有害生物防除剤、殺菌・殺カビ剤、共力剤、除草剤または植物成長調節剤などの 1 種以上の追加の活性処方成分と混合されてもよい。追加の活性処方成分は、いくつかの場合において、予期しない相乗的活性をもたらし得る。

20

【0242】

好適な追加の活性処方成分の例としては、以下のアシルアミノ酸殺菌・殺カビ剤、脂肪族窒素殺菌・殺カビ剤、アミド殺菌・殺カビ剤、アニリド殺菌・殺カビ剤、抗生物質殺菌・殺カビ剤、芳香族殺菌・殺カビ剤、ヒ素殺菌・殺カビ剤、アリールフェニルケトン殺菌・殺カビ剤、ベンズアミド殺菌・殺カビ剤、ベンズアニリド殺菌・殺カビ剤、ベンズイミダゾール殺菌・殺カビ剤、ベンゾチアゾール殺菌・殺カビ剤、植物学的殺菌・殺カビ剤、架橋ジフェニル殺菌・殺カビ剤、カルバメート殺菌・殺カビ剤、カルバニレート殺菌・殺カビ剤、コナゾール殺菌・殺カビ剤、銅殺菌・殺カビ剤、ジカルボキシイミド殺菌・殺カビ剤、ジニトロフェノール殺菌・殺カビ剤、ジチオカルバメート殺菌・殺カビ剤、ジチオラン殺菌・殺カビ剤、フラミド殺菌・殺カビ剤、フラニリド殺菌・殺カビ剤、ヒドラジド殺菌・殺カビ剤、イミダゾール殺菌・殺カビ剤、水銀殺菌・殺カビ剤、モルホリン殺菌・殺カビ剤、有機リン殺菌・殺カビ剤、有機スズ殺菌・殺カビ剤、オキサチン殺菌・殺カビ剤、オキサゾール殺菌・殺カビ剤、フェニルスルファミド殺菌・殺カビ剤、ポリスルフィド殺菌・殺カビ剤、ピラゾール殺菌・殺カビ剤、ピリジン殺菌・殺カビ剤、ピリミジン殺菌・殺カビ剤、ピロール殺菌・殺カビ剤、第 4 級アンモニウム殺菌・殺カビ剤、キノリン殺菌・殺カビ剤、キノン殺菌・殺カビ剤、キノキサリン殺菌・殺カビ剤、ストロビルリン殺菌・殺カビ剤、スルホンアニリド殺菌・殺カビ剤、チアジアゾール殺菌・殺カビ剤、チアゾール殺菌・殺カビ剤、チアゾリジン殺菌・殺カビ剤、チオカルバメート殺菌・殺カビ剤、チオフエン殺菌・殺カビ剤、トリアジン殺菌・殺カビ剤、トリアゾール殺菌・殺カビ剤、トリアゾロピリミジン殺菌・殺カビ剤、尿素殺菌・殺カビ剤、バリンアミド殺菌・殺カビ剤および亜鉛殺菌・殺カビ剤が挙げられる。

30

40

【0243】

好適な追加の活性処方成分の例としてはまた、以下が挙げられる：3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 - ジクロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン - 5 - イル) - アミド、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸メトキシ - [1 - メチル - 2 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) - エチル] - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (2 - ジクロロメチレン - 3 - エチル - 1 - メチル - インダン - 4 - イル) - アミド (1 0 7 2 9 5 7 - 7 1 - 1)、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (4 ' - メチルスルファニ

50

ル - ビフェニル - 2 - イル) - アミド、1 - メチル - 3 - ジフルオロメチル - 4 H - ピラ
 ザール - 4 - カルボン酸 [2 - (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メ
 チル - エチル] - アミド、(5 - クロロ - 2 , 4 - ジメチル - ピリジン - 3 - イル) - (
 2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル - フェニル) - メタノン、(5 - プロモ - 4 - ク
 ロロ - 2 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチル
 - フェニル) - メタノン、2 - { 2 - [(E) - 3 - (2 , 6 - ジクロロ - フェニル) -
 1 - メチル - プロブ - 2 - エン - (E) - イリデンアミノオキシメチル] - フェニル } -
 2 - [(Z) - メトキシイミノ] - N - メチル - アセトアミド、3 - [5 - (4 - クロロ
 - フェニル) - 2 , 3 - ジメチル - イソキサゾリン - 3 - イル] - ピリジン、(E) - N
 - メチル - 2 - [2 - (2 , 5 - ジメチルフェノキシメチル) フェニル] - 2 - メトキシ
 - イミノアセタミド、4 - プロモ - 2 - シアノ - N , N - ジメチル - 6 - トリフルオロメ
 チルベンズイミダゾール - 1 - スルホンアミド、a - [N - (3 - クロロ - 2 , 6 - キシ
 リル) - 2 - メトキシアセタミド] - y - ブチロラクトン、4 - クロロ - 2 - シアノ - N
 、 - ジメチル - 5 - p - トリルイミダゾール - 1 - スルホンアミド、N - アリル - 4、5
 , - ジメチル - 2 - トリメチルシリルチオフエン - 3 - カルボキサミド、N - (1 - シア
 ノ - 1、2 - ジメチルプロピル) - 2 - (2 , 4 - ジクロロフェノキシ) プロピオンアミ
 ド、N - (2 - メトキシ - 5 - ピリジル) - シクロプロパンカルボキサミド、(. + . .
) - c i s - 1 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1
 - イル) - シクロヘプタノール、2 - (1 - t - ブチル) - 1 - (2 - クロロフェニル)
 - 3 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) - プロパン - 2 - オール、2 ' , 6 ' -
 ジプロモ - 2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシ - 4 ' - トリフルオロメチル - 1 , 3
 - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド、1 - イミダゾリル - 1 - (4 ' - クロロフェノ
 キシ) - 3 , 3 - ジメチルブタン - 2 - オン、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - シ
 アノフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] 3 - メトキシアクリレート、
 メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - チオアミドフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオ
 キシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 -
 フルオロフェノキシ) ピリミジン - 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリ
 レート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 , 6 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン -
 4 - イルオキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [
 3 - (ピリミジン - 2 - イルオキシ) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (5 - メチルピリミジン - 2 - イルオキシ) - フェ
 ノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、
 メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (フェニル - スルホニルオキシ) フェノキシ] フェニル
 - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (4 - ニトロフェノキシ
) フェノキシ] フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - フェ
 ノキシフェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジ
 メチル - ベンゾイル) ピロール - 1 - イル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E)
 - 2 - [2 - (3 - メトキシフェノキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチ
 ル (E) - 2 [2 - (2 - フェニルエテン - 1 - イル) - フェニル] - 3 - メトキシアク
 リレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 , 5 - ジクロロフェノキシ) ピリジン - 3 - イ
 ル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - (3 - (1 , 1 , 2 , 2 -
 テトラフルオロエトキシ) フェノキシ) フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル
 (E) - 2 - (2 - [3 - (- ヒドロキシベンジル) フェノキシ] フェニル) - 3 - メ
 トキシアクリレート、メチル (E) - 2 - (2 - (4 - フェノキシピリジン - 2 - イルオ
 キシ) フェニル) - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - n - プ
 ロピルオキシ - フェノキシ) フェニル] 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 -
 [2 - (3 - イソプロピルオキシフェノキシ) フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、
 メチル (E) - 2 - [2 - [3 - (2 - フルオロフェノキシ) フェノキシ] フェニル] -
 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - エトキシフェノキシ) フェ
 ニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (4 - t - ブチル - ピリ

10

20

30

40

50

ジン - 2 - イルオキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [
 2 - [3 - (3 - シアノフェノキシ)フェノキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル (E) - 2 - [2 - [(3 - メチル - ピリジン - 2 - イルオキシメチル)フェ
 ニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - [6 - (2 - メチル - フ
 ェノキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチ
 ル (E) - 2 - [2 - (5 - プロモ - ピリジン - 2 - イルオキシメチル)フェニル] - 3
 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - [2 - (3 - (3 - ヨードピリジン - 2 -
 イルオキシ)フェノキシ)フェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 -
 [2 - [6 - (2 - クロロピリジン - 3 - イルオキシ)ピリミジン - 4 - イルオキシ]フ
 ェニル] - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - [2 - (5 , 6 - ジ
 10
 メチルピラジン - 2 - イルメチルオキシミノメチル)フェニル] - 3 - メトキシアクリレ
 ート、メチル (E) - 2 - { 2 - [6 - (6 - メチルピリジン - 2 - イルオキシ)ピリミ
 ジン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシ - アクリレート、メチル (E) , (E)
) - 2 - { 2 - (3 - メトキシフェニル)メチルオキシミノメチル] - フェニル} - 3 -
 メトキシアクリレート、メチル (E) - 2 - { 2 - (6 - (2 - アジドフェノキシ) - ピ
 リミジン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (
 E) - 2 - { 2 - [6 - フェニルピリミジン - 4 - イル) - メチルオキシミノメチル]フ
 ェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) - 2 - { 2 - [(4 - クロ
 20
 ロフェニル) - メチルオキシミノメチル] - フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メ
 チル (E) - 2 - { 2 - [6 - (2 - n - プロピルフェノキシ) - 1 , 3 , 5 - トリアジ
 ン - 4 - イルオキシ]フェニル} - 3 - メトキシアクリレート、メチル (E) , (E) -
 2 - { 2 - [(3 - ニトロフェニル)メチルオキシミノメチル]フェニル} - 3 - メトキ
 シアクリレート、3 - クロロ - 7 - (2 - アザ - 2 , 7 , 7 - トリメチル - オクタ - 3 -
 エン - 5 - イン)、2 , 6 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - ベン
 ズアミド、3 - ヨード - 2 - プロピニルアルコール、4 - クロロフェニル - 3 - ヨード
 プロパルギルホルマル、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 - プロピニルエチルカルバメ
 ート、2 , 3 , 3 - トリヨードアリルアルコール、3 - プロモ - 2 , 3 - ジヨード - 2 -
 プロピニルアルコール、3 - ヨード - 2 - プロピニル n - プチルカルバメート、3 - ヨード
 - 2 - プロピニル n - ヘキシルカルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルシクロヘキシ
 30
 ル - カルバメート、3 - ヨード - 2 - プロピニルフェニルカルバメート; トリプロモフェ
 ノール、テトラクロロフェノール、3 - メチル - 4 - クロロフェノール、
 3 , 5 - ジメチル - 4 - クロロフェノール、フェノキシエタノール、ジクロロフェン、o
 - フェニルフェノール、m - フェニルフェノール、p - フェニルフェノール、2 - ベンジ
 ル - 4 - クロロフェノール、5 - ヒドロキシ - 2 (5 H) - フラノンなどのフェノール;
 4 , 5 - ジクロロジチアゾリノン、4 , 5 - ベンゾジチアゾリノン、4 , 5 - トリメチレ
 ンジチアゾリノン、4 , 5 - ジクロロ - (3 H) - 1 , 2 - ジチオール - 3 - オン、3 ,
 5 - ジメチル - テトラヒドロ - 1 , 3 , 5 - チアジアジン - 2 - チオン、N - (2 - p -
 クロロベンゾイルエチル) - ヘキサミニウムクロリド、アシベンゾラル、アシベタックス
 、アラニカルブ、アルベンダゾール、アルジモルフ、アリシン、アリルアルコール、アメ
 40
 トクトラジン、アミスルプロム、アモバム、アンプロピルホス、アニラジン、アソメート
 、オーレオフンギン、アザコナゾール、アザフェンジン、アジチラム、アゾキリストロピ
 ン、バリウムポリスルフィド、ベナラキシル、ベナラキシル - M、ベノダニル、ベノミル
 、ベンキノックス、ベントルロン、ベンチアパリカルブ、ベンチアゾール、塩化ベンザル
 コニウム、ベンザマクリル、ベンザモルフ、ベンゾヒドロキサム酸、ベルベリン、ベトキ
 サジン、ピロキサゾール、ピナパクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピチオノール、
 ピキサフェン、ブラストサイジン - S、ボスカリド、プロモタロニル、プロムコナゾール
 、スピリメート、プチオベート、プチルアミン多硫酸カルシウム、カプタホール、キャプ
 タン、カルバモルフ、カルベンダジム、カルベンダジムクロリドレート、カルボキシン、
 カルプロパミド、カルボン、CGA 4 1 3 9 6、CGA 4 1 3 9 7、キノメチオネート、
 キトサン、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロラニル、クロルフェナゾール、
 50

クロロネブ、クロルピクリン、クロロタロニル、クロロゾリネート、クロゾリネート、ク
 リンパゾール、クロトリマゾール、クロジラコン、酢酸銅、炭酸銅、水酸化銅、ナフテン
 酸銅、オレイン酸銅、オキシ塩化銅、オキシキノリン酸銅、ケイ酸銅、硫酸銅、タル油酸
 銅、クロム酸銅亜鉛およびボルドー液などの銅含有化合物、クレゾール、クフラエブ、ク
 プロバム、酸化第一銅、シアゾファミド、シクラフラミド、シクロヘキシミド、シフルフ
 ェナミド、シモキサニル、シペンダゾール、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメッ
 ト、デバカルブ、デカフェンチン、デヒドロ酢酸、ジ - 2 - ビリジルジスルフィド 1, 1
 ' - ジオキシド、ジクロフルアニド、ジクロメジン、ジクロロン、ジクロラン、ジクロロフ
 ェン、ジクロゾリン、ジクロブトラゾール、ジクロシメット、ジエトフェンカルブ、ジフ
 ェノコナゾール、ジフェンゾコート、ジフルメトリム、O, O - ジ - イソ - プロピル - S
 - ベンジルチオホスフェート、ジメフルアゾール、ジメタクロン、ジメトコナゾール、ジ
 メトモルフ、ジメチリモール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ジノプトン、ジノ
 カップ、ジノクトン、ジノペントン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジフェニルアミン、
 ジピリチオン、ジスルフィラム、ジタリムホス、ジチアノン、ジチオエーテル、ドデシル
 ジメチル塩化アンモニウム、ドデモルフ、ドジチン、ドジン、ドグアジン、ドラゾキシロ
 ン、エディフェンホス、エネストロブリン、エポキシコナゾール、エタコナゾール、エテ
 ム、エタボキサム、エチリモール、エトキシキン、エチリシン、エチル (Z) - N - ベン
 ジル - N ([メチル (メチル - チオエチリデンアミノ - オキシカルボニル) アミノ] チオ
) - アラニナト、エトリジアゾール、ファミキサドン、フェンアミドン、フェナミノ
 スルフ、フェナパニル、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキ
 サミド、フェニトロパン、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェ
 ンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、トリフェニルスズヒドロキ
 シド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキシニル、フルメトベル (f
 l u m e t o v e r)、フルモルフ、フルピコリド、フルオピラム、フルオロイミド、フル
 トリマゾール、フルオキサストロピン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルス
 ルファミド、フルタニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホル
 ペット、ホルムアルデヒド、ホセチル、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、
 フルカルパニル、フルコナゾール、ルフラール、フルメシクロックス、フロファネート、
 グリオジン、グリセオフラビン、グアザチン、ハラクリネート、ヘキサクロロベンゼン、
 ヘキサクロロブタジエン、ヘキサクロロフェン、
 ヘキサコナゾール、ヘキシルチオホス、ヒドラルガフェン、ヒドロキシイソキサゾール、
 ヒメキサゾール、イマザリル、硫酸イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、
 三酢酸イミノクタジン、イネジン、ヨードカルブ、イブコナゾール、イプロベンホス、イ
 プロジオン、イプロバリカルブ、イソプロパニルブチルカルバメート、イソプロチオラン
 、イソピラザム、イソチアニル、イソバレジオン、イソバムホス、カスガマイシン、クレ
 ソキシム - メチル、LY 1 8 6 0 5 4、LY 2 1 1 7 9 5、LY 2 4 8 9 0 8、マンコゼ
 ブ、マンジプロパミド、マンネブ、メベニル、メカルピンジド、メフェノキサム、メパニ
 ピリム、メプロニル、塩化第二水銀、塩化第一水銀、メブチルジノカップ、メタラキシル
 、メタラキシル - M、メタム、メタゾキシロン、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メ
 タフロキサム、臭化メチル、ヨウ化メチル、メチルイソチオシアネート、メチラム、メチ
 ラム - 亜鉛、メトミノストロピン、メトラフェノン、メツルホバクス、ミルネブ、モロキ
 シジン、マイクロブタニル、マイクロゾリン、ナーバム、ナタミシン、ネオアソジン、ジメチ
 ルジチオカルバミン酸ニッケル、ニトロスチレン、ニトロタル - イソ - プロピル、ヌアリ
 モル、オクチリノン、オフレース、有機水銀化合物、オリザストロピン、オストール、オ
 キサジキシル、オキサスルフロニ、オキシニル銅、オキシソリン酸、オキスポコナゾール、オ
 キシカルボキシニ、パリノール、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロロン、ペン
 フルフェン、ペンタクロロフェノール、ペンチオピラド、フェナマクリル、フェナジンオ
 キシド、ホスジフェン、ホセチル - A 1、リン酸、フタリド、ピコキシストロピン、ピペ
 ラリン、ポリカルバメート、ポリオキシニ D、ポリオキシリム、ポリラム、プロベナゾー
 ル、プロクロラズ、プロシミドン、プロバミジン、プロバモカルブ、プロピコナゾール、

10

20

30

40

50

プロピネブ、プロピオン酸、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピラカルボリド、ピラクロストロピン、ピラメトロストロピン、ピラオキシストロピン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリジニトリル、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリオフェノン、ピロキロン、ピロキシクロール、ピロキシフル、ピロールニトリン、第4級アンモニウム化合物、キナセトール、キナザミド、キンコナゾール、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、ラベンザゾール、サントニン、セダキサソール、シルチオファミン、シメコナゾール、シブコナゾール、5塩化石炭酸ナトリウム、ソラテノール、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、スルトロペン、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テコラム、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チアジフロル、チシオフエン、チフルザミド、2-(チオシアノメチルチオ)ベンゾチアゾール、チオファネート-メチル、チオキノックス、チラム、チアジニル、チミベンコナゾール、チオキサミド、トルコホス-メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアミホス、トリアリモル、トリアズブチル、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロピン、トリフルマゾール、トリホリン、トリフルミゾール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、ウルバシド、バリダマイシン、バリフェナレート、ババム、ピンクロゾリン、ザリルアミド、ジネブ、ジラム、およびゾキサミド。

10

【0244】

本発明の化合物はまた、駆虫薬薬剤との組み合わせで用いられ得る。このような駆虫薬としては、欧州特許第357460号明細書、欧州特許第444964号明細書および欧州特許第594291号明細書に記載されているとおり、イベルメクチン、アベルメクチン、アバメクチン、エマメクチン、エピリノメクチン、ドラメクチン、セラメクチン、モキシデクチン、ネマデクチンおよびミルベマイシン誘導体などの化合物の大環式ラクトンクラスから選択される化合物が挙げられる。追加の駆虫薬としては、米国特許第5015630号明細書、国際公開第9415944号パンフレットおよび国際公開第9522552号パンフレットに記載されているものなどの半合成および生合成アベルメクチン/ミルベマイシン誘導体が挙げられる。追加の駆虫薬としては、アルベンダゾール、カンベンダゾール、フェンベンダゾール、フルベンダゾール、メベンダゾール、オキシフェンダゾール、オキシベンダゾール、パルベンダゾール、および、このクラスの他の構成要素などのベンズイミダゾールが挙げられる。追加の駆虫薬としては、イミダゾチアゾール、および、テトラミゾール、レバミゾール、パモ酸ピランテル (pyrantel pamoate)、オキサニルまたはモランテルなどのテトラヒドロピリミジンが挙げられる。追加の駆虫薬としては、トリクラベンダゾールおよびクローロロンなどのフルキシド、ならびに、プラジカンテルおよびエブシブランテルなどのセストサイド (cestocide) が挙げられる。

20

30

【0245】

本発明の化合物は、パラヘルクアミド/マルクホルチンクラスの駆虫薬の誘導体および類似体、ならびに、米国特許第5478855号明細書、米国特許第4639771号明細書および独国特許第19520936号明細書に開示されているものなどの抗寄生虫性オキサゾリンとの組み合わせで用いられ得る。

【0246】

本発明の化合物は、国際公開第9615121号パンフレットに記載されている一般的なクラスのジオキソモルホリン抗寄生虫性薬剤の誘導体および類似体との組み合わせで、また、国際公開第9611945号パンフレット、国際公開第9319053号パンフレット、国際公開第9325543号パンフレット、欧州特許第626375号明細書、欧州特許第382173号明細書、国際公開第9419334号パンフレット、欧州特許第382173号明細書、および、欧州特許第503538号明細書に記載のものなどの駆虫活性環式デブシペプチドとの組み合わせで用いられ得る。

40

【0247】

本発明の化合物は、他の外寄生生物撲滅薬；例えば、フィプロニル；ピレスロイド；有機リン酸エステル；ルフェヌロンなどの昆虫成長調節剤；テブフェノジド等などのエクジ

50

ソニアゴニスト；イミダクロプリド等などのネオニコチノイドとの組み合わせで用いられ得る。

【0248】

本発明の化合物は、例えば国際公開第95/19363号パンフレットまたは国際公開第04/72086号パンフレットに記載のものといったテルペンアルカロイドであって、特にこれらに開示の化合物との組み合わせで用いられ得る。

【0249】

本発明の化合物が組み合わされて用いられ得るこのような生物学的に有効な化合物の他の例としては、これらに限定されることはないが、以下が挙げられる。

【0250】

有機リン酸エステル：アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、プロモホス、プロモホス - エチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルピリホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、デメトン、デメトン - S - メチル、デメトン - S - メチルスルホン、ジアリホス、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジスルホトン、エチオン、エトプロホス、エトリムホス、ファンファー、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、フォノホス、ホルモチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イサゾホス、イソチオエート、イソキサチオン、マラチオン、メタクリホス、メタミドホス、メチダチオン、メチル - パラチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン - メチル、パラオキソン、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホサロン、ホスホラン、ホスホカルブ、ホスメット、ホスファミドン、ホレート、ホキシム、ピリミホス、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロバホス、プロエタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダペンチオン、キナルホス、スルプロホス、テメホス、テルブホス、テブピリムホス、テトラクロルピンホス、チメトン (thimeton)、トリアゾホス、トリクロルホン、パミドチオン。

10

20

【0251】

カルバメート：アラニカルブ、アルジカルブ、2 - sec - ブチルフェニルメチルカルバメート、ベンフラカルブ、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、クロエトカルブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ、フェンチオカルブ、フラチオカルブ、HCN - 801、イソプロカルブ、インドキサカルブ、メチオカルブ、メソミル、5 - メチル - m - クメニルブチリル (メチル) カルバメート、オキサミル、ピリミカーブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、UC - 51717。

30

【0252】

ピレスロイド：アクリナチン (acrinathin)、アレトリン、アルファメトリン (alphametrin)、5 - ベンジル - 3 - フリルメチル (E) - (1R) - シス - 2, 2 - ジメチル - 3 - (2 - オキソチオラン - 3 - イリデンメチル) シクロプロパンカルボキシレート、ピフェントリン、 - シフルトリン、シフルトリン、 - シペルメトリン、 - シペルメトリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン ((S) - シクロペンチル異性体)、ピオレスメトリン、ピフェントリン、NCI - 85193、シクロプロトリン、シハロトリン、シチトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エムペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンフルトリン、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、フルバリネート (D 異性体)、イミプロトリン、シハロトリン、 - シハロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、ブラレトリン、プレトリン (天然生成物)、レスメスリン、テトラメトリン、トランスフルトリン、 - シペルメトリン、シラフルオフエン、t - フルバリネート、テフルトリン、トラロメトリン、 - シペルメトリン。

40

【0253】

節足動物成長調節剤：a) キチン合成抑制剤：ベンゾイル尿素：クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルアズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、ブプロフェ

50

ジン、ジオフェノラン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロルフェンタジン；b) エクジソンアンタゴニスト：ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；c) ジュベノイド：ピリプロキシフェン、メトプレン（S-メトプレンを含む）、フェノキシカルブ；d) 脂質生合成抑制剤：スピロジクロフェン。

【0254】

他の抗寄生虫薬：アセキノシル、アミトラズ、AKD-1022、ANS-118、アザジラクチン、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、ベンサルタップ、ピフェナゼート、ピナバクリル、プロモプロピレート、BTG-504、BTG-505、カンフェクロール、カルタップ、クロロベンジレート、クロルジメホルム、クロルフェナピル、クロマフェノジド、クロチアニジン (*clothianidine*)、シロマジン、ジアクロデン、ジアフェンチウロン、DBI-3204、ジナクチン、ジヒドロキシメチルジヒドロキシピロリジン、ジノプトン、ジノカップ、エンドスルファン、エチプロール、エトフェンプロクス、フェナザキン、フルマイト、MTI-800、フェンピロキシメート、フルアクリピリム、フルベンジミン、フルプロシトリネート、フルフェンジン、フルフェンプロックス、フルプロキシフェン、ハロフェンプロックス (*halofenprox*)、ヒドラメチルノン、IKI-220、カネマイト、NC-196、ニームガード、ニジノルテルフラン、ニテンピラム、SD-35651、WL-108477、ピリダリル、プロパルギット、プロトリフェンブト、ピメトロジン (*pymethrozine*)、ピリダベン、ピリミジフェン、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、シラフルオフエン、シロマジン、スピノサド、テブフェンピラド、テトラジホン、テトラナクチン (*tetranactin*)、チアクロプリド、チオシクラム、チアメトキサム、トルフェンピラド、トリアザメート、トリエトキシスピノシン、トリナクチン、ベルブチン、ベルタレク、YI-5301。

10

20

【0255】

生物剤：バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*, *kurstaki*)、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) エンドトキシン、バキュロウイルス、昆虫病原性バクテリア、ウイルスおよび真菌。

30

【0256】

殺菌剤：クロルテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、ストレプトマイシン。

【0257】

他の生物剤：エンロフロキサシン、フェバンテル、ペネタメート、モロキシカム、セファレキシン、カナマイシン、ピモベンダン、クレンブテロール、オメプラゾール、チアムリン、ペナゼプリル、ピリプロール、セフキノム、フロルフェニコール、ブセレリン、セフォベシン、ツラスロマイシン、セフチオウル、カルプロフェン、メタフルミゾン、ブラジクアランテル、トリクラベンダゾール。

【0258】

式Iの化合物と活性処方成分との以下の混合物が好ましい（「TX」という略記は、「本発明の表A1～A27、B1～B10およびC1～C12（上記）に記載の化合物からなる群から選択される1種の化合物」を意味する）。

40

石油（代替名）（628）+TXから構成される物質群から選択される補助剤、
1,1-ビス（4-クロロフェニル）-2-エトキシエタノール（IUPAC名）（910）+TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート（IUPAC/Chemical Abstracts名）（1059）+TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセタミド（IUPAC名）（1295）+TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン（IUPAC名）（981）+TX、アバメクチン（1）+TX、アセキノシル（3）+TX、アセトプロール [CCN] +TX、アクリナトリン（9）+TX、アルジカルブ（16）+TX、アルドキシカルブ（863）+TX、シベルメトリン（202）+TX、アミジチオン（870）+TX、アミドフルメト [CCN] +TX、ア

50

ミドチオエート(872)+TX、アミトン(875)+TX、シュウ酸水素アミトン(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アラマイト(881)+TX、三酸化ヒ素(882)+TX、AVI382(化合物コード)+TX、AZ60541(化合物コード)+TX、アジンホスエチル(44)+TX、アジンホスメチル(45)+TX、アゾベンゼン(IUPAC名)(888)+TX、アゾシクロチン(46)+TX、アゾトエート(889)+TX、ベノミル(62)+TX、ベノキサホス(代替名)[CCN]+TX、ベンゾキメート(71)+TX、ベンジル安息香酸塩(IUPAC名)[CCN]+TX、ピフェナゼート(74)+TX、ピフェントリン(76)+TX、ピナパクリル(907)+TX、プロフェンパレレート(代替名)+TX、プロモシクレン(918)+TX、プロモホス(920)+TX、プロモホスエチル(921)+TX、プロモプロピレート(94)+TX、プロプロフェジン(99)+TX、プトカルボキシム(103)+TX、プトキシカルボキシム(104)+TX、プチルピリダベン(代替名)+TX、多硫酸カルシウム(IUPAC名)(111)+TX、カンフェクロール(941)+TX、カルバノレート(943)+TX、カルバリル(115)+TX、カルボフラン(118)+TX、カルボフェノチオン(947)+TX、CGA50'439(開発コード)(125)+TX、チノメチオナート(126)+TX、クロルベンシド(959)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルムヒドロクロリド(964)+TX、クロルフェナピル(130)+TX、クロルフェネトール(968)+TX、クロルフェンソン(970)+TX、クロルフェンスルフィド(971)+TX、クロルフェンピンホス(131)+TX、クロロベンジラート(975)+TX、クロロメブホルム(977)+TX、クロロメチウロン(978)+TX、クロロプロピレート(983)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロルピリホスメチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、シネリンI(696)+TX、シネリンII(696)+TX、シネリンス(696)+TX、クロフェンテジン(158)+TX、クロサンテル(代替名)[CCN]+TX、クマホス(174)+TX、クロタミトン(代替名)[CCN]+TX、クロトキシホス(1010)+TX、クフラエブ(1013)+TX、シアントエート(1020)+TX、シフルメトフェン(CAS登録番号:400882-07-7)+TX、シハロトリン(196)+TX、シヘキサチン(199)+TX、シベルメトリン(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、デメフィオン(1037)+TX、デメフィオン-O(1037)+TX、デメフィオン-S(1037)+TX、デメトン(1038)+TX、デメトンメチル(224)+TX、デメトン-O(1038)+TX、デメトン-O-メチル(224)+TX、デメトン-S(1038)+TX、デメトン-S-メチル(224)+TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039)+TX、ジアフェンチウロン(226)+TX、ジアリホス(1042)+TX、ダイアジノン(227)+TX、ジクロフルアニド(230)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジコホル(242)+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジエノクロル(1071)+TX、ジメホクス(1081)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジナクチン(代替名)(653)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクスジクレキシム(1089)+TX、ジノプトン(269)+TX、ジノカップ(270)+TX、ジノカップ-4[CCN]+TX、ジノカップ-6[CCN]+TX、ジノクトン(1090)+TX、ジノペントン(1092)+TX、ジノスルホン(1097)+TX、ジノテルボン(1098)+TX、ジオキサチオン(1102)+TX、ジフェニルスルホン(IUPAC名)(1103)+TX、ジスルフィラム(代替名)[CCN]+TX、ジスルホトン(278)+TX、DNOC(282)+TX、ドフェナピン(1113)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エンドスルファン(294)+TX、エンドチオン(1121)+TX、EPN(297)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エチオン(309)+TX、エトエートメチル(1134)+TX、エトキサゾール(320)+TX、エトリムホス(1142)+TX、フェナザフロル(1147)+TX、フェナザキン(328)+TX、酸化

10

20

30

40

50

フェンブタズ (330) + TX、フェノチオカルブ (337) + TX、フェンプロパトリ
 リン (342) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンピロキシメート (345
) + TX、フェンソン (1157) + TX、フェントリファニル (1161) + TX、フ
 ェンバレレート (349) + TX、フィプロニル (354) + TX、フルアクリピリム (3
 60) + TX、フルアズロン (1166) + TX、フルベンジミン (1167) + TX
 、フルシクロクソン (366) + TX、フルシトリネート (367) + TX、フルエネ
 チル (1169) + TX、フルフェノクソン (370) + TX、フルメトリン (372
) + TX、フルオルベンシド (1174) + TX、フルバリネート (1184) + TX、
 FMC 1137 (開発コード) (1185) + TX、ホルメタネート (405) + TX、
 ホルメタネートヒドロクロリド (405) + TX、ホルモチオン (1192) + TX、ホ
 ルムパラネート (1193) + TX、 - HCH (430) + TX、グリオジン (120
 5) + TX、ハルフェンプロクス (424) + TX、ヘプテノホス (432) + TX、ヘ
 キサデシルシクロプロパンカルボキシレート (IUPAC / Chemical Abst
 racts 名) (1216) + TX、ヘキシチアゾクス (441) + TX、ヨードメタン
 (IUPAC 名) (542) + TX、イソカルボホス (代替名) (473) + TX、イソ
 プロピル O - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチレート (IUPAC 名) (473
) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ジャスモリン I (696) + T
 X、ジャスモリン II (696) + TX、ジョドフェンホス (1248) + TX、リンダ
 ン (430) + TX、ルフェヌロン (490) + TX、マラチオン (492) + TX、マ
 ロノベン (1254) + TX、メカルバム (502) + TX、メホスフォラン (1261
) + TX、メスルフェン (代替名) [CCN] + TX、メタクリホス (1266) + TX
 、メタミドホス (527) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチオカルブ (53
 0) + TX、メソミル (531) + TX、臭化メチル (537) + TX、メトルカルブ (5
 50) + TX、メビンホス (556) + TX、メキサカルベート (1290) + TX、
 ミルベメクチン (557) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX
 、ミパホクス (1293) + TX、モノクロトホス (561) + TX、モルホチオン (1
 300) + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ナレド (567) + TX
 、
 NC - 184 (化合物コード) + TX、NC - 512 (化合物コード) + TX、ニフルリ
 ジド (1309) + TX、ニッコマイシン (代替名) [CCN] + TX、ニトリラカルブ
 (1313) + TX、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 (1313) + TX、NNI -
 0101 (化合物コード) + TX、NNI - 0250 (化合物コード) + TX、オメトエ
 ート (594) + TX、オキサミル (602) + TX、オキシデプロホス (1324) +
 TX、オキシジスルホトン (1325) + TX、pp' - DDT (219) + TX、パラ
 チオン (615) + TX、ペルメトリン (626) + TX、石油 (代替名) (628) +
 TX、フェンカプトン (1330) + TX、フェントエート (631) + TX、ホレート
 (636) + TX、ホサロン (637) + TX、ホスホラン (1338) + TX、ホスメ
 ット (638) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホキシム (642) + TX、
 ピリミホスメチル (652) + TX、ポリクロロテルペン (慣習名) (1347) + TX
 、ポリナクチン (代替名) (653) + TX、プロクロノール (1350) + TX、プロ
 フェノホス (662) + TX、プロマシル (1354) + TX、プロバルギット (671
) + TX、プロベタムホス (673) + TX、プロボキスル (678) + TX、プロチダ
 チオン (1360) + TX、プロトエート (1362) + TX、ピレトリン I (696)
 + TX、ピレトリン II (696) + TX、ピレトリン (696) + TX、ピリダベン (6
 99) + TX、ピリダフェンチオン (701) + TX、ピリミジフェン (706) + T
 X、ピリミテート (1370) + TX、キナルホス (711) + TX、キンチオホス (1
 381) + TX、R - 1492 (開発コード) (1382) + TX、RA - 17 (開発コ
 ード) (1383) + TX、ロテノン (722) + TX、シュラダン (1389) + TX
 、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、SI - 000
 9 (化合物コード) + TX、ソファミド (1402) + TX、スピロジクロフェン (73

10

20

30

40

50

8) + TX、スピロメシフェン(739) + TX、SSI-121(開発コード)(1404) + TX、スルフィラム(代替名)[CCN] + TX、スルフラミド(750) + TX、スルホテブ(753) + TX、スルフル(754) + TX、SZI-121(開発コード)(757) + TX、フルパリネート(398) + TX、テブフェンピラド(763) + TX、TEPP(1417) + TX、テルバム(代替名) + TX、テトラクロルピンホス(777) + TX、テトラジホン(786) + TX、テトラナクチン(代替名)(653) + TX、テトラスル(1425) + TX、チアフェノクス(代替名) + TX、チオカルボキシム(1431) + TX、チオファノックス(800) + TX、チオメトン(801) + TX、チオキノックス(1436) + TX、ツリングエンシン(代替名)[CCN] + TX、トリアミホス(1441) + TX、トリアラテン(1443) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、トリクロルホン(824) + TX、トリフェノホス(1455) + TX、トリナクチン(代替名)(653) + TX、バミドチオン(847) + TX、パニリプロール[CCN]およびYI-5302(化合物コード) + TXから構成される物質群から選択される殺ダニ剤、

ベトキサジン[CCN] + TX、ニオクタノン酸銅(IUPAC名)(170) + TX、硫酸銅(172) + TX、シプトリン[CCN] + TX、ジクロン(1052) + TX、ジクロロフェン(232) + TX、エンドタール(295) + TX、フェンチン(347) + TX、消石灰[CCN] + TX、ナーバム(566) + TX、キノクラミン(714) + TX、キノンアミド(1379) + TX、シマジン(730) + TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)および水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347) + TXから構成される物質群から選択される殺藻剤、

アバメクチン(1) + TX、クルホメート(1011) + TX、ドラメクチン(代替名)[CCN] + TX、エマメクチン(291) + TX、エマメクチン安息香酸塩(291) + TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN] + TX、イベルメクチン(代替名)[CCN] + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + TX、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、ピペラジン[CCN] + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、スピノサド(737)およびチオファネート(1435) + TXから構成される物質群から選択される駆虫薬、

クロラロース(127) + TX、エンドリン(1122) + TX、フェンチオン(346) + TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)およびストリキニン(745) + TXから構成される物質群から選択される殺鳥剤、

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン(IUPAC名)(1222) + TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748) + TX、8-硫酸ヒドロキシキノリン(446) + TX、プロノポール(97) + TX、ニオクタノン酸銅(IUPAC名)(170) + TX、水酸化銅(IUPAC名)(169) + TX、クレゾール[CCN] + TX、ジクロロフェン(232) + TX、ジピリチオン(1105) + TX、ドジチン(1112) + TX、フェナミノスルフ(1144) + TX、ホルムアルデヒド(404) + TX、ヒドラルガフェン(代替名)[CCN] + TX、カスガマイシン(483) + TX、カスガマイシンヒドロクロリド水和物(483) + TX、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(1308) + TX、ニトラピリン(580) + TX、オクチリノン(590) + TX、オキシリン酸(606) + TX、オキシテトラサイクリン(611) + TX、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム(446) + TX、プロベナゾール(658) + TX、ストレプトマイシン(744) + TX、ストレプトマイシンセスキスルフェート(744) + TX、テクロフタラム(766) + TX、およびチオメルサル(代替名)[CCN] + TXから構成される物質群から選択される殺バクテリア剤、

リンゴコカクモンハマキ(Adoxophyes orana)GV(代替名)(12) + TX、アグロバクテリウムラジオバクター(Agrobacterium radiobacter)(代替名)(13) + TX、アムプリセイウス属の一種(Amblyseius spp.)(代替名)(19) + TX、アナグラファファルシフェラ(

Anagrapta falcifera) NPV (代替名) (28) + TX、アングルスアトムス (*Anagrus atomus*) (代替名) (29) + TX、アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) (代替名) (33) + TX、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*) (代替名) (34) + TX、ショクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*) (代替名) (35) + TX、オートグラフィカリホルニカ (*Autographa californica* NPV) (代替名) (38) + TX、バシラスフィルムス (*Bacillus firmus*) (代替名) (48) + TX、バシラススファエリクス (*Bacillus sphaericus* Neide) (学名) (49) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* Berliner) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ベアウベリアバツシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ベアウベリアブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオヒメテントウ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、コドリング (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、

ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) および H. メギジス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、ヒポダミアコンベルゲンズ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィクスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer* NPV) および N. レコンテイ (*N. lecontei* NPV) (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属の一種 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイネルネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマカルボカブサエ (*Steinernema carpocapsae*

) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマリオブラ
 エ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、ステ
 イネルネマリオブラビス (*Steinernema riobravis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマスカプテリスキ (*Steinernema scapt
 erisci*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ属の一種 (*Steiner
 nema spp.*) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属の一種 (*Trich
 ogramma spp.*) (代替名) (826) + TX、チフロドロムスオクシデンタ
 リス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) お
 よびベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecanii*) (代替名)
 (848) + TX から構成される物質群から選択される生物剤、
 ヨードメタン (IUPAC名) (542) および臭化メチル (537) + TX から構成さ
 れる物質群から選択される土壌不毛剤、
 アホレート [CCN] + TX、ピサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代
 替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [C
 CN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘムパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] +
 TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [C
 CN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオ
 ヘムパ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン
 (代替名) [CCN] およびウレデパ (代替名) [CCN] + TX から構成される物質群
 から選択される不妊化剤、
 (E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートを伴う (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オ
 ル (IUPAC名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテ
 ート (IUPAC名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オ
 ル (IUPAC名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1
 - イルアセテート (IUPAC名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 -
 イルアセテート (IUPAC名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナル
 (IUPAC名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテ
 ート (IUPAC名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン
 - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (438) + TX、(Z) - イコス - 13 - エン
 - 10 - オン (IUPAC名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 -
 アル (IUPAC名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (I
 UPAC名) (783) + TX、
 (Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (784) + TX
 、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (2
 83) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート
 (IUPAC名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン
 - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1
 - エン (IUPAC名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールを伴う 4 - メ
 チルノナン - 5 - オン (IUPAC名) (544) + TX、 - ムルチストリアチン (代
 替名) [CCN] + TX、プレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルレ (代
 替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、クエルレ (代替名) (1
 79) + TX、ジスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテ
 ート (IUPAC名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUP
 AC名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (I
 UPAC名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、エチル 4 -
 メチルオクタノエート (IUPAC名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [C
 CN] + TX、フロントリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシッブルア (代替名) (4
 20) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) +

10

20

30

40

50

TX、グランドルアII(代替名)(421)+TX、グランドルアIII(代替名)(421)+TX、グランドルアIV(代替名)(421)+TX、ヘキサルア[CCN]+TX、イブスジエノール(代替名)[CCN]+TX、イブセノール(代替名)[CCN]+TX、ジャポニルア(代替名)(481)+TX、リネアチン(代替名)[CCN]+TX、リトルア(代替名)[CCN]+TX、ルーブルア(代替名)[CCN]+TX、メドルア[CCN]+TX、メガトモ酸(代替名)[CCN]+TX、メチルオイゲノール(代替名)(540)+TX、ムスカルア(563)+TX、オクタデカ-2,13-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(588)+TX、オクタデカ-3,13-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(589)+TX、オルフルア(代替名)[CCN]+TX、オリクタールア(代替名)(317)+TX、オストラモン(代替名)[CCN]+TX、シグルア[CCN]+TX、ソルジジン(代替名)(736)+TX、スルカトール(代替名)[CCN]+TX、テトラデカ-11-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(785)+TX、トリメドルア(839)+TX、トリメドルアA(代替名)(839)+TX、トリメドルアB₁(代替名)(839)+TX、トリメドルアB₂(代替名)(839)+TX、トリメドルアC(代替名)(839)およびトランクコール(代替名)[CCN]+TXから構成される物質群から選択される昆虫フェロモン、

10

2-(オクチルチオ)-エタノール(IUPAC名)(591)+TX、プトピロノキシル(933)+TX、プトキシ(ポリプロピレングリコール)(936)+TX、ジブチルアジペート(IUPAC名)(1046)+TX、フタル酸ジブチル(1047)+TX、ジブチルコハク酸塩(IUPAC名)(1048)+TX、ジエチルトルアミド[CCN]+TX、ジメチルカルベート[CCN]+TX、ジメチルフタレート[CCN]+TX、エチルヘキサジオール(1137)+TX、ヘキサミド[CCN]+TX、メトキンブチル(1276)+TX、メチルネオデカンアミド[CCN]+TX、オキサメート[CCN]およびピカリジン[CCN]+TXから構成される物質群から選択される昆虫忌避剤、

20

1-ジクロロ-1-ニトロエタン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1058)+TX、1,1-ジクロロ-2,2-ビス(4-エチルフェニル)-エタン(IUPAC名)(1056)+TX、1,2-ジクロロプロパン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1062)+TX、1,2-ジクロロプロパンを伴う1,3-ジクロロプロペン(IUPAC名)(1063)+TX、1-プロモ-2-クロロエタン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(916)+TX、2,2,2-トリクロロ-1-(3,4-ジクロロフェニル)酢酸エチル(IUPAC名)(1451)+TX、

30

2,2-ジクロロビニル2-エチルスルフィニルエチルメチルリン酸(IUPAC名)(1066)+TX、2-(1,3-ジチオラン-2-イル)フェニルジメチルカルバメート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1109)+TX、2-(2-プトキシエトキシ)エチルチオシアネート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(935)+TX、2-(4,5-ジメチル-1,3-ジオキソラン-2-イル)フェニルメチルカルバメート(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1084)+TX、2-(4-クロロ-3,5-キシリルオキシ)エタノール(IUPAC名)(986)+TX、2-クロロビニルジエチルリン酸(IUPAC名)(984)+TX、2-イミダゾリドン(IUPAC名)(1225)+TX、2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246)+TX、2-メチル(プロブ-2-イニル)アミノフェニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1284)+TX、2-チオシアナトエチルラウレート(IUPAC名)(1433)+TX、3-プロモ-1-クロロプロブ-1-エン(IUPAC名)(917)+TX、3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イルジメチルカルバメート(IUPAC名)(1283)+TX、4-メチル(プロブ-2-イニル)アミノ-3,5-キシリルメチルカルバメート(IUPAC名)(1285)+TX、5,5-ジメチル-3-オキシシクロヘキ

40

50

サ - 1 - エニルジメチルカルバメート (I U P A C 名) (1 0 8 5) + T X、アバメクチ
 ン (1) + T X、アセフェート (2) + T X、アセタミプリド (4) + T X、アセチオン
 (代替名) [C C N] + T X、アセトプロール [C C N] + T X、アクリナトリン (9)
 + T X、アクリロニトリル (I U P A C 名) (8 6 1) + T X、アラニカルブ (1 5) +
 T X、アルジカルブ (1 6) + T X、アルドキシカルブ (8 6 3) + T X、アルドリン (8
 6 4) + T X、アレトリン (1 7) + T X、アロサミジン (代替名) [C C N] + T X
 、アリキシカルブ (8 6 6) + T X、 - シペルメトリン (2 0 2) + T X、 - エクジ
 ソン (代替名) [C C N] + T X、リン化アルミニウム (6 4 0) + T X、アミジチオン
 (8 7 0) + T X、アミドチオエート (8 7 2) + T X、アミノカルブ (8 7 3) + T X
 、アミトン (8 7 5) + T X、シュウ酸水素アミトン (8 7 5) + T X、アミトラズ (2
 4) + T X、アナバシン (8 7 7) + T X、アチダチオン (8 8 3) + T X、A V I 3 8
 2 (化合物コード) + T X、A Z 6 0 5 4 1 (化合物コード) + T X、アザジラクチン (代
 替名) (4 1) + T X、アザメチホス (4 2) + T X、アジンホスエチル (4 4) + T
 X、アジンホスメチル (4 5) + T X、アゾトエート (8 8 9) + T X、バチルスチュー
 リンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) エンドトキシ (代
 替名) (5 2) + T X、バリウムヘキサフルオロシリケート (代替名) [C C N] + T X
 、バリウムポリスルフィド (I U P A C / C h e m i c a l A b s t r a c t s 名) (8
 9 2) + T X、バルトリン [C C N] + T X、バイエル 2 2 / 1 9 0 (開発コード) (8
 9 3) + T X、バイエル 2 2 4 0 8 (開発コード) (8 9 4) + T X、ベンジオカルブ
 (5 8) + T X、ベンフラカルブ (6 0) + T X、ベンサルタップ (6 6) + T X、 -
 シフルトリン (1 9 4) + T X、 - シペルメトリン (2 0 3) + T X、ピフェントリン
 (7 6) + T X、ピオアレトリン (7 8) + T X、ピオアレトリン S - シクロペンテニル
 異性体 (代替名) (7 9) + T X、バイオエタノメトリン [C C N] + T X、ピオパーメ
 トリン (9 0 8) + T X、ピオレスメトリン (8 0) + T X、ビス (2 - クロロエチル)
 エーテル (I U P A C 名) (9 0 9) + T X、ピストリフルロン (8 3) + T X、ホウ酸
 ナトリウム (8 6) + T X、プロフェンバレレート (代替名) + T X、プロムフェンピン
 ホス (9 1 4) + T X、プロモシクレン (9 1 8) + T X、プロモ - D D T (代替名) [C
 C N] + T X、プロモホス (9 2 0) + T X、プロモホスエチル (9 2 1) + T X、プ
 フェンカルブ (9 2 4) + T X、ブプロフェジン (9 9) + T X、ブタカルブ (9 2 6)
 + T X、ブタチオホス (9 2 7) + T X、プトカルボキシム (1 0 3) + T X、プトネー
 ト (9 3 2) + T X、プトキシカルボキシム (1 0 4) + T X、ブチルピリダベン (代替
 名) + T X、カズサホス (1 0 9) + T X、ヒ酸カルシウム [C C N] + T X、
 シアン化カルシウム (4 4 4) + T X、多硫酸カルシウム (I U P A C 名) (1 1 1) +
 T X、カンフェクロール (9 4 1) + T X、カルバノレート (9 4 3) + T X、カルバリ
 ル (1 1 5) + T X、カルボフラン (1 1 8) + T X、二硫化炭素 (I U P A C / C h e
 m i c a l A b s t r a c t s 名) (9 4 5) + T X、四塩化炭素 (I U P A C 名) (9
 4 6) + T X、カルボフェノチオン (9 4 7) + T X、カルボスルファン (1 1 9) +
 T X、カルタップ (1 2 3) + T X、カルタップヒドロクロリド (1 2 3) + T X、セバ
 ジン (代替名) (7 2 5) + T X、クロルピシクレン (9 6 0) + T X、クロルダン (1
 2 8) + T X、クロルデコン (9 6 3) + T X、クロルジメホルム (9 6 4) + T X、ク
 ロルジメホルムヒドロクロリド (9 6 4) + T X、クロルエトキシホス (1 2 9) + T X
 、クロルフェナピル (1 3 0) + T X、クロルフェンピンホス (1 3 1) + T X、クロル
 フルアズロン (1 3 2) + T X、クロルメホス (1 3 6) + T X、クロロホルム [C C N
] + T X、クロルピクリン (1 4 1) + T X、クロルホキシム (9 8 9) + T X、クロル
 プラゾホス (9 9 0) + T X、クロルピリホス (1 4 5) + T X、クロルピリホスメチル
 (1 4 6) + T X、クロルチオホス (9 9 4) + T X、クロマフェノジド (1 5 0) + T
 X、シネリン I (6 9 6) + T X、シネリン I I (6 9 6) + T X、シネリンス (6 9 6)
) + T X、c i s - レスメスリン (代替名) + T X、シスメトリン (8 0) + T X、クロ
 シトリン (代替名) + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、クロサンテル (代替名)
 [C C N] + T X、クロチアニジン (1 6 5) + T X、アセト亜ヒ酸銅 [C C N] + T X

10

20

30

40

50

、ヒ酸銅 [CCN] + TX、オレイン酸銅 [CCN] + TX、クマホス (174) + TX、クミトエート (1006) + TX、クロタミトン (代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス (1010) + TX、クルホメート (1011) + TX、氷晶石 (代替名) (177) + TX、CS708 (開発コード) (1012) + TX、シアノフェンホス (1019) + TX、シアノホス (184) + TX、シアントエート (1020) + TX、シクレトリン [CCN] + TX、シクロプロトリン (188) + TX、シフルトリン (193) + TX、シハロトリン (196) + TX、シベルメトリン (201) + TX、シフェノトリン (206) + TX、シロマジン (209) + TX、シチオエート (代替名) [CCN] + TX、d-リモネン (代替名) [CCN] + TX、d-テトラメトリン (代替名) (788) + TX、DAEP (1031) + TX、ダゾメット (216) + TX、DDT (219) + TX、デカルボフラン (1034) + TX、デルタメトリン (223) + TX、デメフィオン (1037) + TX、デメフィオン-O (1037) + TX、デメフィオン-S (1037) + TX、デメトン (1038) + TX、デメトンメチル (224) + TX、デメトン-O (1038) + TX、デメトン-O-メチル (224) + TX、デメトン-S (1038) + TX、デメトン-S-メチル (224) + TX、デメトン-S-メチルスルホン (1039) + TX、ジアフェンチウロン (226) + TX、ジアリホス (1042) + TX、ジアミダホス (1044) + TX、ダイアジノン (227) + TX、ジカプトン (1050) + TX、ジクロロフェンチオン (1051) + TX、ジクロルボス (236) + TX、ジクリホス (代替名) + TX、ジクレシル (代替名) [CCN] + TX、ジクロトホス (243) + TX、ジシクラニル (244) + TX、ディルドリン (1070) + TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルリン酸 (IUPAC名) (1076) + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジロール (代替名) [CCN] + TX、ジメフルトリン [CCN] + TX、ジメホクス (1081) + TX、ジメタン (1085) + TX、ジメトエート (262) + TX、ジメトリン (1083) + TX、ジメチルピンホス (265) + TX、ジメチラン (1086) + TX、ジネクス (1089) + TX、ジネクスジクレキシシ (1089) + TX、ジノプロブ (1093) + TX、ジノサム (1094) + TX、ジノセブ (1095) + TX、ジノテフラン (271) + TX、ジオフェノラン (1099) + TX、ジオキサベンゾホス (1100) + TX、ジオキサカルブ (1101) + TX、ジオキサチオン (1102) + TX、ジスルホトン (278) + TX、ジチクロホス (1108) + TX、DNOC (282) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、DSP (1115) + TX、エクジステロン (代替名) [CCN] + TX、EI1642 (開発コード) (1118) + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、EMP C (1120) + TX、

エムペントリン (292) + TX、エンドスルファン (294) + TX、エンドチオン (1121) + TX、エンドリン (1122) + TX、EPBP (1123) + TX、EPN (297) + TX、エポフェノナン (1124) + TX、エピリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、エスフェンバレレート (302) + TX、エタホス (代替名) [CCN] + TX、エチオフエンカルブ (308) + TX、エチオン (309) + TX、エチプロール (310) + TX、エトエートメチル (1134) + TX、エトプロホス (312) + TX、ギ酸エチル (IUPAC名) [CCN] + TX、エチル-DDD (代替名) (1056) + TX、エチレンジプロミド (316) + TX、ジクロロエタン (化学名) (1136) + TX、エチレンオキシド [CCN] + TX、エトフェンブロックス (319) + TX、エトリムホス (1142) + TX、EXD (1143) + TX、ファンファー (323) + TX、フェナミホス (326) + TX、フェナザフロル (1147) + TX、フェンクロールホス (1148) + TX、フェネタカルブ (1149) + TX、フェンフルトリン (1150) + TX、フェニトロチオン (335) + TX、フェノブカルブ (336) + TX、フェノキサクリム (1153) + TX、フェノキシカルブ (340) + TX、フェンピリトリン (1155) + TX、フェンプロパトリン (342) + TX、フェンピラド (代替名) + TX、フェンスルホチオン (1158) + TX、フェンチオン (3

46) + TX、フェンチオンエチル [CCN] + TX、フェンバレレート (349) + TX、
 フィプロニル (354) + TX、フロニカミド (358) + TX、フルベンジアミド
 (CAS登録番号: 272451-65-7) + TX、フルコフロン (1168) + TX、
 フルシクロクソン (366) + TX、フルシトリネート (367) + TX、フルエネ
 チル (1169) + TX、フルフェネリム [CCN] + TX、フルフェノクソン (37
 0) + TX、フルフェンブロックス (1171) + TX、フルメトリン (372) + TX
 、フルバリネート (1184) + TX、FMC 1137 (開発コード) (1185) + T
 X、フォノホス (1191) + TX、ホルメタネート (405) + TX、ホルメタネート
 ヒドロクロリド (405) + TX、ホルモチオン (1192) + TX、ホルムパラネート
 (1193) + TX、ホスメチラン (1194) + TX、ホスピレート (1195) + T
 X、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、フラチオカル
 ブ (412) + TX、フレトリン (1200) + TX、 - シハロトリン (197) + T
 X、 - HCH (430) + TX、グアザチン (422) + TX、グアザチン酢酸塩 (4
 22) + TX、GY-81 (開発コード) (423) + TX、ハルフェンブロクス (42
 4) + TX、ハロフェノジド (425) + TX、HCH (430) + TX、HEOD (1
 070) + TX、ヘプタクロル (1211) + TX、ヘプテノホス (432) + TX、ヘ
 テロホス [CCN] + TX、ヘキサフルムロン (439) + TX、HHDN (864) +
 TX、ヒドラメチルノン (443) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヒドロプレ
 ン (445) + TX、ヒキンカルブ (1223) + TX、イミダクロプリド (458) +
 TX、イミプロトリン (460) + TX、インドキサカルブ (465) + TX、ヨードメ
 タン (IUPAC名) (542) + TX、IPSP (1229) + TX、イサゾホス (1
 231) + TX、イソベンザン (1232) + TX、イソカルボホス (代替名) (473
) + TX、イソドリン (1235) + TX、イソフェンホス (1236) + TX、イソラ
 ン (1237) + TX、イソプロカルブ (472) + TX、イソプロピルO- (メトキシ
 アミノチオホスホリル) サリチレート (IUPAC名) (473) + TX、イソプロチオ
 ラン (474) + TX、イソチオエート (1244) + TX、イソキサチオン (480)
 + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ジャスモリンI (696) + TX
 、ジャスモリンII (696) + TX、ジョドフェンホス (1248) + TX、幼虫ホル
 モンI (代替名) [CCN] + TX、幼虫ホルモンII (代替名) [CCN] + TX、幼
 虫ホルモンIII (代替名) [CCN] + TX、ケレバン (1249) + TX、キノブレ
 ン (484) + TX、 - シハロトリン (198) + TX、硫酸鉛 [CCN] + TX、レ
 ピメクチン (CCN) + TX、レプトホス (1250) + TX、リンダン (430) + T
 X、リリムホス (1251) + TX、ルフェヌロン (490) + TX、リチダチオン (1
 253) + TX、m-クメニルメチルカルバメート (IUPAC名) (1014) + TX
 、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) + TX、マラチオン (492) + TX
 、
 マロノベン (1254) + TX、マジドクス (1255) + TX、メカルバム (502)
 + TX、メカルホン (1258) + TX、メナゾン (1260) + TX、メホスフォラン
 (1261) + TX、塩化第一水銀 (513) + TX、メスルフェンホス (1263) +
 TX、メタフルミゾン (CCN) + TX、メタム (519) + TX、メタムカリウム (代
 替名) (519) + TX、メタムナトリウム (519) + TX、メタクリホス (1266
) + TX、メタミドホス (527) + TX、ノルニコチン (IUPAC / Chemica
 l Abstracts名) (1268) + TX、メチダチオン (529) + TX、メチ
 オカルブ (530) + TX、メトクロトホス (1273) + TX、メソミル (531) +
 TX、メトブレン (532) + TX、メトキンブチル (1276) + TX、メトトリン (代
 替名) (533) + TX、メトキシクロル (534) + TX、メトキシフェノジド (5
 35) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + T
 X、メチルクロホルム (代替名) [CCN] + TX、塩化メチレン [CCN] + TX、
 メトフルトリン [CCN] + TX、メトルカルブ (550) + TX、メトキサジアゾン (1
 288) + TX、メビンホス (556) + TX、メキサカルベート (1290) + TX

10

20

30

40

50

、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、ミパホクス(1293)+TX、ミレックス(1294)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ナフトロホス(代替名)[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、ナフトレン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1303)+TX、NC-170(開発コード)(1306)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、ニコチン(578)+TX、ニコチンスルフェート(578)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニテンピラム(579)+TX、ニチアジン(1311)+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、ノルニコチン(慣習名)(1319)+TX、ノバルロン(585)+TX、ノピフルムロン(586)+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057)+TX、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオネート(IUPAC名)(1074)+TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオネート(IUPAC名)(1075)+TX、O,O,O',O'-テトラプロピルジチオピロホスフェート(IUPAC名)(1424)+TX、オレイン酸(IUPAC名)(593)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデメトンメチル(609)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN]+TX、パラチオン(615)+TX、パラチオンメチル(616)+TX、ペンフルロン(代替名)[CCN]+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC名)(623)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(代替名)(628)+TX、PH60-38(開発コード)(1328)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェントリン(630)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスニクロル(1339)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、ホキシム(642)+TX、ホキシムメチル(1340)+TX、ピリメタホス(1344)+TX、ピリミカーブ(651)+TX、ピリミホスエチル(1345)+TX、ピリミホスメチル(652)+TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346)+TX、ポリクロロテルペン(慣習名)(1347)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、カリウムチオシアネート[CCN]+TX、

プラレトリン(655)+TX、プレコセンI(代替名)[CCN]+TX、プレコセンII(代替名)[CCN]+TX、プレコセンIII(代替名)[CCN]+TX、プリミドホス(1349)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロフルトリン[CCN]+TX、プロマシル(1354)+TX、プロメカルブ(1355)+TX、プロバホス(1356)+TX、プロペタムホス(673)+TX、プロボキスル(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロチオホス(686)+TX、プロトエート(1362)+TX、プロトリフェンブト[CCN]+TX、ピメトロジン(688)+TX、ピラクロホス(689)+TX、ピラゾホス(693)+TX、プレスメトリン(1367)+TX、プレトリンI(696)+TX、プレトリンII(696)+TX、プレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダリル(700)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、ピリプロキシフェン(708)+TX、カシヤ(代替名)[CCN]+TX、キナルホス(711)+TX、キナルホスメチル(1376)+TX、キノチオン(1380)+TX、キンチオホス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、ラホキサニド(代替名)[CCN]+TX、レスメスリン(719)+TX、ロテノン(722)+TX、RU15525(開発コード)(72

10

20

30

40

50

3) + TX、RU25475 (開発コード) (1386) + TX、リアニア (代替名) (1387) + TX、リアノジン (慣習名) (1387) + TX、サバジラ (代替名) (725) + TX、シュラダン (1389) + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、SI-0009 (化合物コード) + TX、SI-0205 (化合物コード) + TX、SI-0404 (化合物コード) + TX、SI-0405 (化合物コード) + TX、シラフルオフエン (728) + TX、SN72129 (開発コード) (1397) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX、シアン化ナトリウム (444) + TX、ナトリウムフッ化物 (IUPAC/Chemical Abstracts 名) (1399) + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム (1400) + TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩 (623) + TX、セレン酸ナトリウム (IUPAC 名) (1401) + TX、チオシアン酸ナトリウム [CCN] + TX、ソファミド (1402) + TX、スピノサド (737) + TX、スピロメシフェン (739) + TX、スピロテトラマト (CCN) + TX、スルコフロソ (746) + TX、スルコフロソナトリウム (746) + TX、スルフラミド (750) + TX、スルホテブ (753) + TX、スルフルルフッ化物 (756) + TX、スルプロホス (1408) + TX、タール油 (代替名) (758) + TX、 β -フルパリネート (398) + TX、チオナジン (1412) + TX、TDE (1414) + TX、テブフェノジド (762) + TX、テブフェンピラド (763) + TX、テブピリムホス (764) + TX、テフルベンズロン (768) + TX、テフルトリソ (769) + TX、テムホス (770) + TX、TEPP (1417) + TX、テラレスリン (1418) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロエタン [CCN] + TX、テトラクロルピソホス (777) + TX、テトラメトリソ (787) + TX、 β -シペルメトリソ (204) + TX、チアクロプリド (791) + TX、チアフェノクス (代替名) + TX、チアメトキサム (792) + TX、チクロホス (1428) + TX、チオカルボキシム (1431) + TX、チオシクラム (798) + TX、チオシクラム水素オキサレート (798) + TX、チオジカルブ (799) + TX、チオフアノックス (800) + TX、チオメトン (801) + TX、チオナジン (1434) + TX、チオスルタップ (803) + TX、チオスルタップナトリウム (803) + TX、ツリンギエンシソ (代替名) [CCN] + TX、トルフェンピラド (809) + TX、トラロメトリソ (812) + TX、トランスフルトリソ (813) + TX、トランスパーメトリソ (1440) + TX、トリアミホス (1441) + TX、トリアザメート (818) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、トリクロルホソ (824) + TX、トリクロルメタホス-3 (代替名) [CCN] + TX、トリクロロナト (1452) + TX、トリフェノホス (1455) + TX、トリフルムロン (835) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、トリプレソ (1459) + TX、パミドチオン (847) + TX、パニリプロール [CCN] + TX、
 ベラトリジン (代替名) (725) + TX、ベラトリソ (代替名) (725) + TX、XMC (853) + TX、キシリルカルブ (854) + TX、YI-5302 (化合物コード) + TX、 β -シペルメトリソ (205) + TX、メトリソ (代替名) + TX、亜鉛ホスフィド (640) + TX、ゾラプロホス (1469) および ZXI8901 (開発コード) (858) + TX、シアントラニリプロール [736994-63-19] + TX、クロラントラニリプロール [500008-45-7] + TX、シエノピラフェソ [560121-52-0] + TX、シフルメトフェソ [400882-07-7] + TX、ピリフルキナゾソ [337458-27-2] + TX、スピネトラム [187166-40-1] + TX、スピロテトラマト [203313-25-1] + TX、スルホキサフロル [946578-00-3] + TX、フルフィプロール [704886-18-0] + TX、メベルフルトリソ [915288-13-0] + TX、テトラメチルフルトリソ [84937-88-2] + TX、トリフルメゾピリソ (国際公開第2012/092115号パンフレットに開示されている) + TX から構成される物質群から選択される殺虫剤、

10

20

30

40

50

ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913)+TX、プロモアセタミド[CCN]+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、クロエトカルブ(999)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、硫酸銅(172)+TX、フェンチン(347)+TX、第二鉄リン酸(IUPAC名)(352)+TX、メタアルデヒド(518)+TX、メチオカルブ(530)+TX、ニコロアミド(576)+TX、ニコロアミドオラミン(576)+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩(623)+TX、チオナジン(1412)+TX、チオジカルブ(799)+TX、酸化トリブチルスズ(913)+TX、トリフェンモルフ(1454)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)および水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TX、ピリプロール[394730-71-3]+TXから構成される物質群から選択される殺軟体動物剤、

AKD-3088(化合物コード)+TX、1,2-ジブロモ-3-クロロプロパン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1045)+TX、1,2-ジクロロプロパン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1062)+TX、1,2-ジクロロプロパンを伴う1,3-ジクロロプロペン(IUPAC名)(1063)+TX、1,3-ジクロロプロペン(233)+TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフエン1,1-ジオキシド(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1065)+TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルロダニン(IUPAC名)(980)+TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸(IUPAC名)(1286)+TX、6-イソペンテニルアミノプリン(代替名)(210)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アラニカルブ(15)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、AZ60541(化合物コード)+TX、ベンクロチアズ[CCN]+TX、ベノミル(62)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、カズサホス(109)+TX、カルボフラン(118)+TX、二硫化炭素(945)+TX、カルボスルファン(119)+TX、クロルピクリン(141)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロエトカルブ(999)+TX、サイトカイニン(代替名)(210)+TX、ダゾメット(216)+TX、DBC P(1045)+TX、DCIP(218)+TX、ジアミダホス(1044)+TX、ジクロロフェンチオン(1051)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジメトエート(262)+TX、ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エトプロホス(312)+TX、エチレンジプロミド(316)+TX、

フェナミホス(326)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、ホスチアゼート(408)+TX、ホスチエタン(1196)+TX、ルフラール(代替名)[CCN]+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ヘテロホス[CCN]+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、イサミドホス(1230)+TX、イサゾホス(1231)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、カイネチン(代替名)(210)+TX、メカルホン(1258)+TX、メタム(519)+TX、メタムカリウム(代替名)(519)+TX、メタムナトリウム(519)+TX、臭化メチル(537)+TX、メチルイソチオシアネート(543)+TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN]+TX、モキシデクチン(代替名)[CCN]+TX、ミロテシウムベルカリア(Myrothecium verrucaria)組成物(代替名)(565)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、オキサミル(602)+TX、ホレート(636)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホスホカルブ[CCN]+TX、セブホス(代替名)+TX、セラメクチン(代替名)[CCN]+TX、スピノサド(737)+TX、テルバム(代替名)+TX、テルブホス(773)+TX、テトラクロロチオフエン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1422)+TX、チアフェノクス(代替名)+TX

10

20

30

40

50

、チオナジン(1434)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、キシレノルス[CCN]+TX、YI-5302(化合物コード)およびゼアチン(代替名)(210)+TX、フルエンシルホン[318290-98-1]+TXから構成される物質群から選択される殺線虫剤、
 エチルキサントゲン酸カリウム[CCN]およびニトラピリン(580)+TXから構成される物質群から選択される硝化抑制剤、
 アシベンゾラル(6)+TX、アシベンゾラル-S-メチル(6)+TX、プロベナゾール(658)およびオオイタドリ(*Reynoutria sachalinensis*)抽出物(代替名)(720)+TXから構成される物質群から選択される植物活性化剤、
 2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246)+TX、4-(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)+TX、
 -クロロヒドリン[CCN]+TX、リン化アルミニウム(640)+TX、アンツ(880)+TX、三酸化ヒ素(882)+TX、炭酸バリウム(891)+TX、ビスチオセミ(912)+TX、プロジファクム(89)+TX、プロマジオロン(91)+TX、プロメタリン(92)+TX、シアン化カルシウム(444)+TX、クロラロース(127)+TX、クロロファシノン(140)+TX、コレカルシフェロール(代替名)(850)+TX、クマクロル(1004)+TX、クマフリル(1005)+TX、クマテトラリル(175)+TX、クリミジン(1009)+TX、ジフェナクム(246)+TX、ジフェチアロン(249)+TX、ジファシノン(273)+TX、
 エルゴカルシフェロール(301)+TX、フロクマフェン(357)+TX、フルオロアセタミド(379)+TX、フルプロバジン(1183)+TX、フルプロバジンヒドロクロリド(1183)+TX、
 -HCH(430)+TX、HCH(430)+TX、シアン化水素(444)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、リンダン(430)+TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640)+TX、臭化メチル(537)+TX、ノルボルミド(1318)+TX、ホスアセチム(1336)+TX、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、リン[CCN]+TX、ピンドン(1341)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、ピリヌロン(1371)+TX、シリロシド(1390)+TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN]+TX、シアン化ナトリウム(444)+TX、フルオロ酢酸ナトリウム(735)+TX、ストリキニン(745)+TX、
 硫酸タリウム[CCN]+TX、ワルファリン(851)および亜鉛ホスフィド(640)+TXから構成される物質群から選択される殺鼠剤、
 2-(2-プトキシエトキシ)-エチルピペロニレート(IUPAC名)(934)+TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシルシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903)+TX、ファルネソールを伴うネロリドール(代替名)(324)+TX、MB-599(開発コード)(498)+TX、MGK264(開発コード)(296)+TX、ピペロニルプトキシド(649)+TX、ピプロタル(1343)+TX、プロピル異性体(1358)+TX、S421(開発コード)(724)+TX、セサメックス(1393)+TX、セサスモリン(1394)およびスルホキシド(1406)+TXから構成される物質群から選択される共力剤、
 アントラキノン(32)+TX、クロラロース(127)+TX、ナフテン酸銅[CCN]+TX、オキシ塩化銅(171)+TX、ダイアジノン(227)+TX、ジシクロペントジエン(化学名)(1069)+TX、グアザチン(422)+TX、グアザチン酢酸塩(422)+TX、メチオカルブ(530)+TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)+TX、チラム(804)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、ナフテン酸亜鉛[CCN]およびジラム(856)+TXから構成される物質群から選択される動物忌避剤、
 イマニン(代替名)[CCN]およびリバピリン(代替名)[CCN]+TXから構成される物質群から選択される抗ウイルス剤、
 酸化水銀(II)(512)+TX、オクチリノン(590)およびチオファネートメチ

10

20

30

40

50

ル(802)+TXから構成される物質群から選択される創傷保護剤、
 ならびに、アザコナゾール[60207-31-0]+TX、ピテルタノール[7058
 5-36-3]+TX、プロムコナゾール[116255-48-2]+TX、シブココ
 ナゾール[94361-06-5]+TX、ジフェンコナゾール[119446-68-
 3]+TX、ジニコナゾール[83657-24-3]+TX、エポキシコナゾール[1
 06325-08-0]+TX、フェンブコナゾール[114369-43-6]+TX
 、フルキンコナゾール[136426-54-5]+TX、フルシラゾール[85509
 -19-9]+TX、フルトリアホル[76674-21-0]+TX、ヘキサコナゾ
 ール[79983-71-4]+TX、イマザリル[35554-44-0]+TX、イ
 ミベンコナゾール[86598-92-7]+TX、イブコナゾール[125225-2
 8-7]+TX、メトコナゾール[125116-23-6]+TX、ミクロブタニル[
 88671-89-0]+TX、ペフラゾエート[101903-30-4]+TX、ペ
 ンコナゾール[66246-88-6]+TX、プロチオコナゾール[178928-7
 0-6]+TX、ピリフェノックス[88283-41-4]+TX、プロクロラズ[6
 7747-09-5]+TX、プロピコナゾール[60207-90-1]+TX、シメ
 コナゾール[149508-90-7]+TX、テブコナゾール[107534-96-
 3]+TX、テトラコナゾール[112281-77-3]+TX、トリアジメホン[4
 3121-43-3]+TX、トリアジメノール[55219-65-3]+TX、トリ
 フルミゾール[99387-89-0]+TX、トリチコナゾール[131983-72
 -7]+TX、アンシミドール[12771-68-5]+TX、フェナリモル[601
 68-88-9]+TX、ヌアリモル[63284-71-9]+TX、ブピリメート[
 41483-43-6]+TX、ジメチリモール[5221-53-4]+TX、エチリ
 モール[23947-60-6]+TX、ドデモルフ[1593-77-7]+TX、フ
 エンプロピジン[67306-00-7]+TX、フェンプロピモルフ[67564-9
 1-4]+TX、スピロキサミン[118134-30-8]+TX、トリデモルフ[8
 1412-43-3]+TX、シブロジニル[121552-61-2]+TX、メパニ
 ピリム[110235-47-7]+TX、ピリメタニル[53112-28-0]+T
 X、フェンピクロニル[74738-17-3]+TX、フルジオキシソニル[13134
 1-86-1]+TX、ベナラキシル[71626-11-4]+TX、フララキシル[
 57646-30-7]+TX、メタラキシル[57837-19-1]+TX、R-メ
 タラキシル[70630-17-0]+TX、オフレース[58810-48-3]+T
 X、オキサジキシル[77732-09-3]+TX、
 ベノミル[17804-35-2]+TX、カルベンダジム[10605-21-7]+
 TX、デバカルブ[62732-91-6]+TX、フベリダゾール[3878-19-
 1]+TX、チアベンダゾール[148-79-8]+TX、クロゾリネート[8433
 2-86-5]+TX、ジクロゾリン[24201-58-9]+TX、イブロジオン[
 36734-19-7]+TX、ミクロゾリン[54864-61-8]+TX、プロシ
 ミドン[32809-16-8]+TX、ピンクロゾリン[50471-44-8]+T
 X、ボスカリド[188425-85-6]+TX、カルボキシシン[5234-68-4
]+TX、フェンフラム[24691-80-3]+TX、フルトラニル[66332-
 96-5]+TX、メプロニル[55814-41-0]+TX、オキシカルボキシシン[
 5259-88-1]+TX、ペンチオピラド[183675-82-3]+TX、チフ
 ルザミド[130000-40-7]+TX、グアザチン[108173-90-6]+
 TX、ドジン[2439-10-3][112-65-2](遊離塩基)+TX、イミノ
 クタジン[13516-27-3]+TX、アゾキシストロピン[131860-33-
 8]+TX、ジモキシストロピン[149961-52-4]+TX、エネストロピン{
 Proc. BCPC, Int. Congr., Glasgow, 2003, 1, 93}+
 TX、フルオキサストロピン[361377-29-9]+TX、クレソキシムメチル[
 143390-89-0]+TX、メトミノストロピン[133408-50-1]+T
 X、トリフロキシストロピン[141517-21-7]+TX、オリザストロピン[2

10

20

30

40

50

48593-16-0]+TX、ピコキシストロピン[117428-22-5]+TX
 、ピラクロストロピン[175013-18-0]+TX、フェルバム[14484-6
 4-1]+TX、マンコゼブ[8018-01-7]+TX、マンネブ[12427-3
 8-2]+TX、メチラム[9006-42-2]+TX、プロピネブ[12071-8
 3-9]+TX、チラム[137-26-8]+TX、ジネブ[12122-67-7]
 +TX、ジラム[137-30-4]+TX、カプタホール[2425-06-1]+T
 X、キャプタン[133-06-2]+TX、ジクロフルアニド[1085-98-9]
 +TX、フルオロイミド[41205-21-4]+TX、ホルペット[133-07-
 3]+TX、トリルフルアニド[731-27-1]+TX、ポルドー液[8011-6
 3-0]+TX、水酸化銅(II)[20427-59-2]+TX、塩化銅[1332
 -40-7]+TX、硫酸銅[7758-98-7]+TX、酸化銅(II)[1317
 -39-1]+TX、マンカップ[53988-93-5]+TX、オキシ銅[10
 380-28-6]+TX、ジノカップ[131-72-6]+TX、ニトロタルイソプ
 ロピル[10552-74-6]+TX、エディフェンホス[17109-49-8]+
 TX、イプロベンホス[26087-47-8]+TX、イソプロチオラン[50512
 -35-1]+TX、ホスジフェン[36519-00-3]+TX、ピラゾホス[13
 457-18-6]+TX、トルコホスメチル[57018-04-9]+TX、アシベ
 ンゾラル-S-メチル[135158-54-2]+TX、アニラジン[101-05-
 3]+TX、ベンチアバリカルブ[413615-35-7]+TX、プラストサイジン
 -S[2079-00-7]+TX、チノメチオナート[2439-01-2]+TX、
 クロロネブ[2675-77-6]+TX、クロロタロニル[1897-45-6]+T
 X、シフルフェナミド[180409-60-3]+TX、シモキサニル[57966-
 95-7]+TX、ジクロン[117-80-6]+TX、ジクロシメット[13992
 0-32-4]+TX、ジクロメジン[62865-36-5]+TX、ジクロラン[9
 9-30-9]+TX、ジエトフェンカルブ[87130-20-9]+TX、ジメトモ
 ルフ[110488-70-5]+TX、SYP-LI90(フルモルフ)[21186
 7-47-9]+TX、ジチアノン[3347-22-6]+TX、エタボキサム[16
 2650-77-3]+TX、エトリジアゾール[2593-15-9]+TX、ファモ
 キサドン[131807-57-3]+TX、フェンアミドン[161326-34-7
]+TX、フェノキサニル[115852-48-7]+TX、フェンチン[668-3
 4-8]+TX、フェリムゾン[89269-64-7]+TX、フルアジナム[796
 22-59-6]+TX、フルオピコリド[239110-15-7]+TX、フルスル
 ファミド[106917-52-6]+TX、フェンヘキサミド[126833-17-
 8]+TX、ホセチルアルミニウム[39148-24-8]+TX、
 ヒメキサゾール[10004-44-1]+TX、イプロバリカルブ[140923-1
 7-7]+TX、IKF-916(シアゾファミド)[120116-88-3]+TX
 、カスガマイシン[6980-18-3]+TX、メタスルホカルブ[66952-49
 -6]+TX、メトラフェノン[220899-03-6]+TX、ペンシクロン[66
 063-05-6]+TX、フタリド[27355-22-2]+TX、ポリオキシシ
 ン[11113-80-7]+TX、プロベナゾール[27605-76-1]+TX、プロ
 パモカルブ[25606-41-1]+TX、プロキナジド[189278-12-4]
 +TX、ピロキロン[57369-32-1]+TX、キノキシフェン[124495-
 18-7]+TX、キントゼン[82-68-8]+TX、スルフル[7704-34-
 9]+TX、チアジニル[223580-51-6]+TX、トリアゾキシド[7245
 9-58-6]+TX、トリシクラゾール[41814-78-2]+TX、トリホリン
 [26644-46-2]+TX、バリダマイシン[37248-47-8]+TX、ゾ
 キキサミド(RH7281)[156052-68-5]+TX、マンジプロパミド[37
 4726-62-2]+TX、イソピラザム[881685-58-1]+TX、セダキ
 サン[874967-67-6]+TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピ
 ラゾール-4-カルボン酸(9-ジクロロメチレン-1,2,3,4-テトラヒドロ-1

10

20

30

40

50

, 4 - メタノンナフタレン - 5 - イル) - アミド (国際公開第 2007/048556 号パンフレットに開示されている) + TX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3', 4', 5' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第 2006/087343 号パンフレットに開示されている) + TX、[(3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル)オキシ] - 1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b - デカヒドロ - 6, 12 - ジヒドロキシ - 4, 6a, 12b - トリメチル - 11 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2H, 11H ナフト [2, 1 - b] ピラノ [3, 4 - e] ピラン - 4 - イル]メチル - シクロプロパンカルボキシレート [915972 - 17 - 7] + TX および 1, 3, 5 - トリメチル - N - (2 - メチル - 1 - オキソプロピル) - N - [3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - [2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル)エチル]フェニル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド [926914 - 55 - 8] + TX。

【0259】

例えば [3878 - 19 - 1] といった有効成分に続く括弧中の参照は、Chemical Abstracts Registry number を指している。上記の混合相手は公知である。有効成分が「The Pesticide Manual」[The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council] 中に含まれている場合、これらは、特定の化合物について本明細書中上記の丸括弧中に示されている項目番号下でその中に記載されており；例えば、化合物「アバメクチン」は、項目番号 (1) 下に記載されている。上記に記載の特定の化合物について「[CCN]」が付記されている場合、対象の化合物は [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright (著作権) 1995 - 2004] にてインターネットを介してアクセス可能である「Compendium of Pesticide Common Names」に含まれており；例えば、化合物「アセトプロール」は、インターネットアドレス <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> において記載されている。

【0260】

上記明細書において、上記の活性処方成分の大部分は、いわゆる「慣用名」、関連する「ISO 慣用名」または他の「慣用名」を個々の事例において用いることにより言及されている。「慣用名」による呼称ではない場合、代わりに用いられる呼称の性質は特定の化合物について丸括弧中に記載されており；この場合、IUPAC 名、IUPAC / Chemical Abstracts 名、「化学名」、「慣習名」、「化合物名」もしくは「開発コード」が用いられており、または、これらの呼称もしくは「慣用名」のいずれも用いられていない場合には、「代替名」が採用されている。「CAS 登録番号」とは、Chemical Abstracts Registry Number を意味する。

【0261】

表 A1 ~ A27、B1 ~ B10 および C1 ~ C12 (上記) から選択される式 I の化合物と、上記の活性処方成分との活性処方成分混合物は、表 A1 ~ A27、B1 ~ B10 および C1 ~ C12 (上記) から選択される化合物と、上記の活性処方成分とを、100 : 1 ~ 1 : 6000、特に 50 : 1 ~ 1 : 50、特に 20 : 1 ~ 1 : 20 の比、特に 10 : 1 ~ 1 : 10、特に 5 : 1 ~ 1 : 5 の混合比で含んでいることが好ましく、2 : 1 ~ 1 : 2 の比が特に好ましく、および、4 : 1 ~ 2 : 1 の比が同様に好ましく、とりわけ、1 : 1、または、5 : 1、または、5 : 2、または、5 : 3、または、5 : 4、または、4 : 1、または、4 : 2、または、4 : 3、または、3 : 1、または、3 : 2、または、2 : 1、または、1 : 5、または、2 : 5、または、3 : 5、または、4 : 5、または、1 : 4、または、2 : 4、または、3 : 4、または、1 : 3、または、2 : 3、または、1 : 2、または、1 : 600、または、1 : 300、または、1 : 150、または、1 : 35

10

20

30

40

50

、または、2 : 3 5、または、4 : 3 5、または、1 : 7 5、または、2 : 7 5、または、4 : 7 5、または、1 : 6 0 0 0、または、1 : 3 0 0 0、または、1 : 1 5 0 0、または、1 : 3 5 0、または、2 : 3 5 0、または、4 : 3 5 0、または、1 : 7 5 0、または、2 : 7 5 0、または、4 : 7 5 0の比が好ましい。これらの混合比は、重量比である。

【0262】

上記の混合物は、上記の混合物を含む組成物を有害生物もしくはその環境に適用するステップを含む有害生物を防除する方法において用いられることが可能であるが、手術もしくは治療によるヒトもしくは動物の身体の処置法、および、ヒトまたは動物の身体において実施される診断法は除かれる。

10

【0263】

表A1～A27、B1～B10およびC1～C12（上記）から選択される式Iの化合物と、上記の1種以上の活性処方成分を含む混合物は、例えば、単一の「調合済み」形態で、単一の活性処方成分コンポーネントの個々の配合物から組成される「タンク混合物」などの複合型噴霧混合物で、および、逐次的（すなわち、数時間または数日間などの適度に短時間のうちに次々と）に適用される場合には単一の活性処方成分を併用して適用されることが可能である。表A1～A27、B1～B10およびC1～C12（上記）から選択される式Iの化合物と上記の活性処方成分を適用する順番は本発明の作用については重要ではない。

【0264】

本発明による組成物はまた、例えば未エポキシ化またはエポキシ化植物性油（例えばエポキシ化ココナツ油、ナタネ油またはダイズ油）といった安定化剤、例えばシリコン油といった消泡剤、防腐剤、粘度調節剤、バインダおよび/もしくは粘着剤、肥料、または、特定の効果を達成するための他の活性処方成分、例えば殺菌剤、殺菌・殺カビ剤、抗線虫薬、植物活性化剤、殺軟体動物剤もしくは除草剤などのさらなる固体助剤もしくは液体助剤を含んでいることが可能である。

20

【0265】

本発明による組成物は、それ自体は公知である様式において、助剤の不在下で、例えば、固体活性処方成分を粉末化し、スクリーニングし、および/または、固体に圧縮することにより調製され、また、少なくとも1種の助剤の存在下に、例えば、活性処方成分を助剤と共に均質混合し、および/または、粉末化することにより調製される。組成物のこれらの調製プロセス、および、これらの組成物を調製するための化合物Iの使用もまた本発明の主題である。

30

【0266】

本発明の他の態様は、式Iの化合物もしくは上記に定義されている好ましい個別の化合物、少なくとも1種の式Iの化合物もしくは少なくとも1種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む組成物、または、少なくとも1種の式Iの化合物もしくは少なくとも1種の上記に定義されている好ましい個別の化合物を含む殺菌・殺カビもしくは殺虫性混合物であって、上記の他の殺菌・殺カビ剤もしくは殺虫剤を伴う混和物における使用であり、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、または、昆虫もしくは好ましくは真菌性生物といった植物病原性微生物による非生体材料に係る外寄生を防除もしくは予防するための使用に関する。

40

【0267】

本発明のさらなる態様は、作物植物、例えば種子といったその繁殖体、例えば収穫された食品作物といった収穫された作物などの例えば有用な植物といった植物、または、昆虫、もしくは、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による非生体材料に係る外寄生を防除もしくは予防する方法に関し、この方法は、式Iの化合物もしくは上記に定義されている好ましい個別の化合物を、活性処方成分として植物、植物の一部もしくはその生息地、その繁殖体、または、非

50

生体材料のいずれかの部分に適用するステップを含む。

【0268】

防除もしくは予防とは、昆虫による、または、特に真菌性生物といった植物病原性もしくはヒトに対して潜在的に有害である腐敗性微生物もしくは生物による外寄生を、向上が実証されるレベルまで低減させることを意味する。

【0269】

特に真菌性生物といった植物病原性微生物または昆虫による作物植物の外寄生を防除もしくは予防する好ましい方法であって、式Iの化合物または前記化合物の少なくとも1種を含有する農芸化学組成物の適用を含む方法は、葉面処理である。適用頻度および適用量は、対応する病原体または昆虫による外寄生のリスクに応じることとなる。しかしながら、式Iの化合物はまた、植物の生息地に液体配合物を灌注することにより、または、例えば粒状形態（土壌施用）の固体形態で化合物を土壌に適用することにより、土壌（浸透移行作用）を介して根から植物に浸透させることが可能である。水稻作物の場合、このような粒質物を湛水した水田に適用することが可能である。式Iの化合物はまた、種子または塊茎を殺菌・殺カビ剤の液体配合物に含浸させることにより、または、これらを固体配合物でコーティングすることにより、種子に適用（コーティング）され得る。

10

【0270】

例えば、式Iの化合物と、所望の場合に、式Iの化合物をカプセル化する固体または液体補助剤またはモノマーとを含有する組成物といった配合物は、公知の様式で、典型的には、化合物を例えば溶剤、固体キャリアおよび任意選択により表面活性化合物（界面活性剤）といった増量剤と一緒に均質に混合し、および/または、粉碎することにより調製され得る。

20

【0271】

流行している状況における意図される目的、および、上述の種類の有害生物を防除するための組成物の使用に適合するよう選択されるべきである、吹付け、噴霧、散粉、はけ塗り、粉衣、拡散または流しかけなどの上述の種類の有害生物の防除方法である組成物の適用方法が本発明の他の主題である。典型的な濃度割合は、0.1~1000ppm、好ましくは0.1~500ppmの活性処方成分である。1ヘクタール当たりの適用量は、好ましくは1g~2000gの活性処方成分/ヘクタール、より好ましくは10~1000g/ha、最も好ましくは10~600g/haである。種子灌注剤として用いられる場合、簡便な投与量は、1kgの種子に対して10mg~1gの活性物質である。

30

【0272】

本発明の組み合わせが種子の処理に用いられる場合、1kgの種子に対して0.001~50gの式Iの化合物、好ましくは、1kgの種子に対して0.01~10gの量が一般に十分とされる。

【0273】

好適には、本発明に係る式(I)の化合物を含む組成物は、病害の発生前を意味する予防的に、または、病害の発生後を意味する治療的に適用される。

【0274】

本発明の組成物は、いずれかの従来形態、例えば、二液系、乾燥種子処理用粉末(DS)、種子処理用エマルジョン(ES)、種子処理用流動性濃縮物(FS)、種子処理用溶液(LS)、種子処理用水分散性粉末(WS)、種子処理用カプセル懸濁液(CF)、種子処理用ゲル(GF)、エマルジョン濃縮物(EC)、懸濁液濃縮物(SC)、サスポエマルジョン(SE)、カプセル懸濁液(CS)、水分散性顆粒(WG)、乳化性顆粒(EG)、エマルジョン、油中水型(EO)、エマルジョン、水中油型(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油分散体(OD)、油混和性の流動体(OF)、混油性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、超低体積懸濁液(SU)、超低体積液体(UL)、工業用濃縮物(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、または、農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物の形態で採用され得る。

40

【0275】

50

このような組成物は、従来の様式で、例えば活性処方成分を、適切な不活性配合物（希釈剤、溶剤、充填材、ならびに、界面活性剤、殺生剤、不凍剤、展着剤、増粘剤およびアジュバント活性効果をもたらす化合物などの任意により他の配合成分）と混合することにより、生成され得る。また、従来の緩効性配合物は、長期にわたって持続する効力が意図される場合に採用され得る。特に、水分散性濃縮物（例えばEC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等）、水和剤および顆粒などの吹付け形態で適用される配合物は、例えばホルムアルデヒドとナフタレンスルホン酸塩との縮合物、アルキルアリアルスルホネート、リグニンスルホン酸塩、脂肪アルキルスルフェート、およびエトキシ化アルキルフェノールおよびエトキシ化脂肪族アルコールといった、湿潤剤および分散剤およびアジュバント効果をもたらす他の化合物などの界面活性剤を含有していてもよい。

10

【0276】

種子粉衣配合物は種子にそれ自体公知である様式で適用され、例えば水性懸濁液または種子に良好な接着性を有する乾燥粉末形態といった好適な種子粉衣配合物形態で、本発明の組み合わせおよび希釈剤を利用する。このような種子粉衣配合物は技術分野において公知である。種子粉衣配合物は、単一種の活性処方成分を含有していても、または、例えば緩効性カプセルもしくはマイクロカプセルとしてカプセル化形態で活性処方成分の組み合わせを含有していてもよい。

【0277】

普通、配合物は、0.01~90重量%の活性薬剤、0~20%の農学的に許容可能な界面活性剤、ならびに、10~99.99%の固体または液体不活性配合物および補助剤を含み、活性薬剤は、少なくとも式Iの化合物を、コンポーネント(B)および(C)、および、任意により他の活性薬剤、特に殺菌剤または防腐剤等を一緒に伴って構成されている。組成物の濃縮形態は、一般に、約2~80%、好ましくは約5~70重量%の活性薬剤を含有する。配合物の適用形態は、例えば0.01~20重量%、好ましくは0.01~5重量%の活性薬剤を含有し得る。市販製品は濃縮物として配合されていることが好ましいであろうが、エンドユーザーは通常希釈した配合物を利用することとなる。

20

【0278】

市販の製品を濃縮物として配合することが好ましいが、エンドユーザーは通常配合物を希釈して使用するであろう。

【実施例】

30

【0279】

以下の実施例は本発明を例示するものである。本発明の一定の化合物は低施用量でのより高い効力により公知の化合物から区別可能であり、これは、実施例において概説されている実験手法を用い、必要に応じて、例えば50ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppmまたは0.2ppmといったより少ない施用量を用いることで当業者により検証可能である。

【0280】

本記載を通じて、温度は摂氏度で示されており、「m.p.」は融点を意味する。LC/MSは液体クロマトグラフィ質量分析を意味し、用いた装置および方法の説明は以下のとおりである。

40

【0281】**方法G:**

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオンまたは陰イオン、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：30~60V、抽出器：2.00V、ソース温度：150、脱溶媒温度：350、コーンガス流：0L/Hr、脱溶媒ガス流：650L/Hr、質量範囲：100~900Da）およびWaters製Acquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード-アレイ検出器を備えるWaters製の質量分光計（ACQUITY UPLC）（SQD、SQDIIまたはZQシングル四重極型質量分析計）で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード-アレイ検出器。カラム：Waters U

50

PLC HSS T3、 $1.8\ \mu\text{m}$ 、 $30 \times 2.1\ \text{mm}$ 、温度： 60 、DAD波長範囲 (nm)： $210 \sim 500$ 、溶剤勾配：A = 水 + $5\% \text{MeOH}$ + $0.05\% \text{HCOOH}$ 、B = アセトニトリル + $0.05\% \text{HCOOH}$ 、勾配：1.2分間で $10 \sim 100\% \text{B}$ ；流量 (ml/min) 0.85

【0282】

方法H：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース（極性：陽イオンまたは陰イオン、キャピラリー： $3.00\ \text{kV}$ 、コーン範囲： $30 \sim 60\ \text{V}$ 、抽出器： $2.00\ \text{V}$ 、ソース温度： 150 、脱溶媒温度： 350 、コーンガス流： $0\ \text{L/Hr}$ 、脱溶媒ガス流： $650\ \text{L/Hr}$ 、質量範囲： $100 \sim 900\ \text{Da}$ ）およびWaters製Acquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード-アレイ検出器を備えるWaters製の質量分光計（ACQUITY UPLC）（SQD、SQDIIまたはZQシングル四重極型質量分析計）で記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオード-アレイ検出器。カラム：Waters UPLC HSS T3、 $1.8\ \mu\text{m}$ 、 $30 \times 2.1\ \text{mm}$ 、温度： 60 、DAD波長範囲 (nm)： $210 \sim 500$ 、溶剤勾配：A = 水 + $5\% \text{MeOH}$ + $0.05\% \text{HCOOH}$ 、B = アセトニトリル + $0.05\% \text{HCOOH}$ 、勾配：2.7分間で $10 \sim 100\% \text{B}$ ；流量 (ml/min) 0.85

10

【0283】

方法J：

計測は株式会社島津製作所製のSPD-20Aで行った。

溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラム、被加熱カラムコンパートメントおよび紫外線検出器。カラム：Diamondsil C18(2) $5\ \mu\text{m}$ $150 \times 4.6\ \text{mm}$ 。オープン温度 ()： 40.0 。最高温度 ()： 80.0 。SPD-20A波長範囲 (nm)： $210 \sim 500$ 。溶剤勾配：A = H_2O + $0.1\% \text{TFA}$ 、B = ACN + $0.1\% \text{TFA}$

20

【0284】

【表2】

時間	A%	B%	流量(ml/min)
0.00	90	10	1.00
15.00	0	100	1.00
25.00	0	100	1.00
27.00	90	10	1.00
36.00	90	10	1.00

30

【0285】

配合物実施例

【0286】

【表 3】

水和剤	a)	b)	c)	
活性処方成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %	
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	-	
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	-	5 %	
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	-	6 %	10 %	
フェノールポリエチレングリコールエーテル (7~8 mol のエチレンオキシド)	-	2 %	-	
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %	10
カオリン	62 %	27 %	-	

【0287】

活性処方成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈された所望の濃度の懸濁液をもたらすことが可能である水和剤を得た。

【0288】

【表 4】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)	
活性処方成分[式(I)の化合物]	25 %	50 %	75 %	20
軽質鉱油	5 %	5 %	5 %	
高分散ケイ酸	5 %	5 %	-	
カオリン	65 %	40 %	-	
タルカム	-	-	20	

【0289】

活性処方成分を補助剤と十分に混合すると共に混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得た。

【0290】

【表 5】

乳化性濃縮物			
活性処方成分[式(I)の化合物]	10 %		
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル (4~5 mol のエチレンオキシド)	3 %		
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %		
ヒマシ油ポリグリコールエーテル(35 mol のエチレンオ キシド)	4 %		
シクロヘキサノン	30 %		
キシレン混合物	50 %		40

【0291】

植物の保護において用いられることが可能である、任意の必要とされる希釈率のエマルジョンを、この濃縮物から水による希釈で得ることが可能である。

【0292】

【表 6】

粉剤	a)	b)	c)
活性処方成分[式(I)の化合物]	5%	6%	4%
タルカム	95%	-	-
カオリン	-	94%	-
無機充填材	-	-	96%

【0293】

すぐに使用可能な粉剤は、活性処方成分とキャリアとを混合し、この混合物を好適なミルで粉砕することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣に用いられることも可能である。

10

【0294】

押出し顆粒

活性処方成分 [式 (I) の化合物] 15%

リグノスルホン酸ナトリウム 2%

カルボキシメチルセルロース 1%

カオリン 82%

【0295】

活性処方成分を補助剤と混合および粉砕し、この混合物を水で湿らせる。この混合物を押し出し、次いで、空気流中で乾燥させる。

20

【0296】

コーティングされた顆粒

活性処方成分 [式 (I) の化合物] 8%

ポリエチレングリコール (mol . wt . 200) 3%

カオリン 89%

【0297】

細かく粉砕した活性処方成分を、ミキサ中において、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉末を発生しないコーティングされた顆粒がこのようにして得られる。

30

【0298】

懸濁液濃縮物

活性処方成分 [式 (I) の化合物] 40%

プロピレングリコール 10%

ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル (15 mol のエチレンオキシド) 6%

リグノスルホン酸ナトリウム 10%

カルボキシメチルセルロース 1%

シリコン油 (75% 水中エマルジョンの形態) 1%

水 32%

40

【0299】

細かく粉砕した活性処方成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

【0300】

種子処理に係る流動性濃縮物

活性処方成分 [式 (I) の化合物] 40%

プロピレングリコール 5%

コポリマーブタノール PO / EO 2%

50

10 ~ 20モルのEOを伴うトリスチレンフェノール 2%
 1, 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン (20%水溶液の形態) 0.5%
 モノアゾ - 顔料カルシウム塩 5%
 シリコン油 (75%水中エマルジョンの形態) 0.2%
 水 45.3%

【0301】

細かく粉碎した活性処方成分を補助剤と均質に混合して懸濁液濃縮物を得、水で希釈することによって、この懸濁液を任意の所望の濃度で得ることが可能である。このような希釈を用いることで、吹付け、注ぎかけ、または、浸漬により、微生物による外寄生から、生存している植物ならびに植物繁殖体を処理および保護可能である。

10

【0302】

緩効性カプセル懸濁液

28部の組み合わせた式Iの化合物を、2部の芳香族溶剤および7部のトルエンジイソシアネート/ポリメチレン-ポリフェニルイソシアネート混合物(8:1)と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤および51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化させる。このエマルジョンに、5.3部の水中の2.8部の1, 6 - ジアミノヘキサンの混合物を添加する。この混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。

【0303】

得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤および3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の活性処方成分を含有する。中程度のカプセル径は8~15ミクロンである。

20

【0304】

得られる配合物を、目的に好適な装置中において、水性懸濁液として種子に適用する。

【0305】

調製例

実施例1: この実施例は5-フルオロ-1-(7-フルオロ-ピロロ[1, 2-b]ピリダジン-3-イル)-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロ-イソキノリンの調製を例示する

a) ピロロ[1, 2-b]ピリダジン-3-カルボニトリルの調製

ナトリウム(E)-2-シアノ-3, 3-ジメトキシ-プロブ-1-エン-1-オレエート(1.80当量、0.877mol、144.8g)のMeOH(1.62L、0.54mol/l)中の懸濁液に、濃塩酸(12mol/l、7.00当量、3.41mmol、284ml)を温度が20を超えないようにゆっくりと添加し、この混合物を室温で20分間攪拌した。次いで、1-アミノピロール(1.00当量、0.487mol、40.0g)の150mlのMeOH中の溶液を2時間かけてゆっくりと添加し、この混合物を還流でさらに2時間加熱した。この反応混合物を室温に冷却し、減圧下で元の体積の1/3に濃縮し、次いで、飽和水性NaHCO₃を添加することにより中和した。混合物をTBMEで抽出し、組み合わせた有機相をNa₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して100mgのオレンジ色の残渣を得、これをフラッシュクロマトグラフィ(ヘプタン中の30%EtOAc)により精製して、ピロロ[1, 2-b]ピリダジン-3-カルボニトリル(0.293mol、44.3g、59%収率)を黄色の固体として得た。¹H-NMR(400MHz, CDCl₃): (ppm) = 6.87(1H, dd, J = 4.58, 1.28Hz), 7.08(1H, dd, J = 4.58, 2.75Hz), 7.93-8.01(1H, m), 8.13-8.17(2H, m); LC-MS, UV検出: 220nm; Rt = 0.89, MS: (M+1) = 144.1

30

40

【0306】

b) 7-フルオロピロロ[1, 2-b]ピリダジン-3-カルボニトリルの調製

ピロロ[1, 2-b]ピリダジン-3-カルボニトリル(1.00当量、69.9mmol、10.0g)の水(1.00L、0.07mol/l)中の懸濁液にSelect

50

fluor (登録商標) (1.50当量、105 mmol、37.1 g) を添加し、この混合物を50 (浴温度60) で2時間加熱した。この反応混合物を室温に冷まし、次いで、DCMで抽出した。組み合わせた有機相をNa₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して8.1 gの濃い緑色の残渣を得、これをフラッシュクロマトグラフィ(シクロヘキサン中の0~25% EtOAc)により精製して、7-フルオロピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボニトリル(24.8 mmol、4.00 g、35%収率)を黄色の固体として得た。¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): (ppm) = 6.66(1H, dd, J = 4.77, 3.30 Hz), 6.80(1H, t, J = 4.95 Hz), 8.10(1H, t, J = 2.20 Hz), 8.19(1H, d, J = 2.20 Hz); ¹⁹F-NMR(377 MHz, CDCl₃): (ppm) = -135.81(1 F, s); LC-MS, UV検出: 220 nm; Rt = 0.95, MS: (M+1) = 162

【0307】

c) 5-フルオロ-1-(7-フルオロ-ピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-イル)-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロ-イソキノリンの調製

室温の7-フルオロピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボニトリル(1.0当量、3.10 mmol、0.500 g)の1,2-ジクロロエタン(31 ml、0.1 mol/l)およびトリフルオロメタンスルホン酸(25当量、78 mmol、6.9 ml)中の溶液に、1-(2-フルオロフェニル)-2-メチル-プロパン-2-オール(3.0当量、9.3 mmol、1.6 g)を6回に分けて2時間30分間の時間をかけて添加した。この反応混合物を室温で19時間攪拌し、次いで、飽和水性NaHCO₃にゆっくりと注ぎ入れた。混合物をDCMで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して2.6 gの濃い黄色の残渣を得、これをフラッシュクロマトグラフィ(シクロヘキサン中の0~25% EtOAc)により精製して、5-フルオロ-1-(7-フルオロ-ピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-イル)-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロ-イソキノリン(1.6 mmol、0.50 g、50%収率)を緑色のかかった黄色のガムとして得た。¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): (ppm) = 1.32(6H, s), 2.84(2H, s), 6.46(1H, dd, J = 4.77, 3.30 Hz), 6.50-6.54(1H, m), 7.17-7.25(2H, m), 7.26-7.33(1H, m), 7.93(1H, t, J = 2.38 Hz), 8.42(1H, d, J = 2.20 Hz); ¹⁹F-NMR(377 MHz, CDCl₃): (ppm) = -141.68(1F, s), -120.31(1F, s); LC-MS, UV検出: 220 nm; Rt = 1.08, MS: (M+1) = 312

【0308】

実施例2: この実施例は3,3-ジメチル-1-ピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-イル-4H-イソキノリンの調製を例示する

a) 1,3,3-トリメチル-4H-イソキノリンの調製

アセトニトリル(1.5 g、37 mmol)を98%硫酸(50 g、0.5 mol)に0 でゆっくりと添加した。次いで、2-メチル-1-フェニル-プロパン-2-オール(5.0 g、33 mmol)をこの溶液に0 で添加した。この反応混合物を室温に冷まし、1時間この温度で攪拌し、pH9の水酸化ナトリウム水溶液に注ぎ入れた。この混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を水および塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させて1,3,3-トリメチル-4H-イソキノリン(4.3 g、25 mmol、74%)を得たところ、これは十分に純度が高いものであり、そのまま次のステップにおいて用いた。¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): (ppm) = 1.20(s, 6H), 2.37(s, 3H), 2.69(s, 2H), 7.14(d, 1H), 7.27-7.36(m, 2H), 7.48(d, 1H).

【0309】

b) 2-(3,3-ジメチル-2,4-ジヒドロイソキノリン-1-イリデン)プロパン

ジアールの調製

ジメチルホルムアミド (1.3 g、18 mmol) を 14 ml のキシレンに添加し、この混合物を 0 に冷却した。オリシ塩化リン (2.2 g、14 mmol) を滴下し、得られる混合物を 0 でさらに 30 分間攪拌し、次いで、室温に到達させた。その後、1, 3, 3 - トリメチル - 4 H - イソキノリン (1.0 g、5.8 mmol) の 2 ml のキシレン中の溶液を添加し、得られる混合物を 90 に 20 時間加熱し、その後、室温に冷却した。この反応混合物を 10 ml の 20 % 水性水酸化ナトリウム溶液に外部から冷却しながらゆっくりと添加し、次いで、60 および 250 mbar で 1 時間攪拌し、次いで、80 および 200 mbar で 6 時間攪拌して水およびジメチルアミンを除去した。次いで、得られる懸濁液を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させた。残渣を酢酸エチルおよびヘプタンを溶離液として用いるシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、2 - (3, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イリデン) プロパンジアール (0.9 g、3.7 mmol、64%) を明るい黄色の固体として得た。¹H - NMR (400 MHz, CDCl₃): (ppm) = 1.32 (s, 6H), 2.91 (s, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.39 (t, 1H), 7.54 (t, 1H), 7.65 (d, 1H), 9.80 (s, 2H), 12.11 (bs, 1H)。

【0310】

c) 3, 3 - ジメチル - 1 - ピロロ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - イル - 4 H - イソキノリンの調製

塩酸 (93 mg、2.5 mmol) を 2 - (3, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イリデン) プロパンジアール (80 mg、0.3 mmol) および 1 - アミノピロール (30 mg、0.4 mmol) の 3 ml のメタノール中の溶液に室温で添加した。この反応混合物を 2 時間加熱還流し、室温に冷却し、飽和炭酸ナトリウム水溶液に注ぎ入れた。この混合物を酢酸エチルで抽出し、有機相を水および塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させた。残渣を酢酸エチルおよびヘプタンを溶離液として用いるシリカゲルによるクロマトグラフィにより精製して、3, 3 - ジメチル - 1 - ピロロ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - イル - 4 H - イソキノリン (80 mg、0.3 mmol、80%) を得た。¹H - NMR (400 MHz, CDCl₃): (ppm) = 1.27 (s, 6H), 2.80 (s, 2H), 6.59 (d, 1H), 6.90 (d, 1H), 7.23 - 7.42 (m, 4H), 7.81 (t, 1H), 7.96 (d, 1H), 8.38 (d, 1H)。

【0311】

実施例 3: この実施例は 3 - (4, 4, 5 - トリフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - イソキノリン) ピロロ [1, 2 - b] ピリダジン - 7 - カルボニトリルの調製を例示する

a) 5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - ピロロ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - イル - 4 H - イソキノリンの調製

室温のピロロ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボニトリル (7.00 mmol、1.00 g) の 1, 2 - ジクロロエタン (0.10 M、70 ml) 中の溶液に、トリフルオロメタンスルホン酸 (25 当量、170 mmol、15 ml) を添加し、続いて、1 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - プロパン - 2 - オール (3.00 当量、21.0 mmol、3.50 g) を数回 (5 時間かけて 6 回) に分けて添加し、この反応混合物を室温でさらに 2 時間攪拌した。この反応混合物を冷却し、飽和 NaHCO₃ 水溶液に注意深く注ぎ入れ、水性相をジクロロメタンで抽出した。組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - ピロロ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - イル - 4 H - イソキノリン (0.84 g、41% 収率) をオレンジ色の油として得たところ、これは静置させると結晶化するものであった: mp 213 ~ 214 ; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) (ppm) = 1.26 - 1.39 (m, 6H) 2.85 (s, 2H) 6.64 (dd, J = 4.80 Hz, 1H) 6.84 - 7.05 (m, 1

10

20

30

40

50

H) 7.15 - 7.35 (m, 3H) 7.79 - 7.91 (m, 1H) 7.98 (s, J = 5.66 Hz, 1H) 8.39 (d, J = 5.54 Hz, 1H); ¹⁹F NMR (377 MHz, CDCl₃) (ppm) = -120.48 (s, 1F); LC-MS (方法 H) UV検出: 220 nm, Rt = 1.00; MS: (M+1) = 294。

【0312】

b) 1-(7-プロモピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリンの調製

5-フルオロ-3,3-ジメチル-1-ピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-イル-4H-イソキノリン(2.2 mmol、660 mg)のMeCN(0.10 M、23 ml)中の冷却した溶液(0℃)にN-プロモスクシンイミド(1.0当量、2.2 mmol、0.40 g)を添加し、この反応混合物を0℃で20分間撹拌した。この反応混合物を氷水に注ぎ入れ、水性相をEtOAcで抽出した。組み合わせた有機相を水および塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、1-(7-プロモピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン(0.74 g、84%収率)をオレンジ色の油として得た: ¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) (ppm) = 1.29 - 1.32 (m, 6H) 2.83 (s, 2H) 6.71 (d, J = 4.77 Hz, 1H) 6.97 (d, J = 4.40 Hz, 1H) 7.14 - 7.26 (m, 3H) 7.98 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.48 (d, J = 2.20 Hz, 1H); ¹⁹F NMR(377 MHz, CDCl₃) (ppm) = -118.82 (s, 1F); LC-MS(方法 H) UV検出: 220 nm, Rt = 1.35; MS: (M+1) = 372 - 374。

10

20

【0313】

c) 3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-1-イル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリルの調製

室温の1-(7-プロモピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-イル)-5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン(0.27 mmol、100 mg)のDMF(0.20 M、1.3 ml)中の溶液に、シアン化亜鉛(2.0当量、0.54 mmol、63 mg)およびPd(PPh₃)₄(0.10当量、0.027 mmol、31 mg)を添加し、この反応混合物をマイクロ波中において、160℃で30分間加熱した。この反応混合物を室温に冷まし、EtOAcで希釈し、水および塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-1-イル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリル(70 mg、80%収率)をオレンジ色の固体として得た: mp 118 ~ 136℃; ¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) (ppm) = 1.29 - 1.34 (m, 6H) 2.84 (s, 2H) 6.64 (d, J = 4.40 Hz, 1H) 7.11 (dd, J = 7.70, 1.10 Hz, 1H) 7.20 - 7.26 (m, 1H) 7.26 - 7.29 (m, 1H) 7.39 (d, J = 4.77 Hz, 1H) 8.07 (d, J = 2.20 Hz, 1H) 8.60 (d, J = 2.20 Hz, 1H); ¹⁹F NMR(377 MHz, CDCl₃) (ppm) = -119.72 (s, 1F); LC-MS(方法 H) UV検出: 220 nm, Rt = 1.55; MS: (M+1) = 319。

30

40

【0314】

d) 5-プロモ-3-(5-フルオロ-4-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-1-イル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリルの調製

室温の3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-1-イル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリル(0.35 mmol、140 mg)のCCl₄(0.20 M、1.8 ml)中の溶液に、N-プロモスクシンイミド(2.0当量、0.70 mmol、126 mg)およびAIBN(0.05当量、0.018 mmol、2.9 mg)を添加し、この反応混合物を70℃で2時間撹拌した。この反応混合物

50

を室温に冷まし、EtOAcで希釈し、水および塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮して、5-ブロモ-3-(4-ブロモ-5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-1-イル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリル(180mg)をオレンジ色の固体として得、これをさらに精製することなく次のステップにおいてそのまま用いた： ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) (ppm) = 1.66(s, 6H) 2.71(s, 1H) 7.14(d, $J = 7.22$ Hz, 1H) 7.21-7.28(m, 1H) 7.35(s, 2H) 8.00(br. s., 1H) 8.58(d, $J = 1.83$ Hz, 1H); ^{19}F NMR(377MHz, CDCl_3) (ppm) = -118.82(s, 1F); LC-MS(方法H) UV検出: 220nm, Rt = 2.06; MS: (M+1) = 477。

10

【0315】

5-ブロモ-3-(4-ブロモ-5-フルオロ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-1-イル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリル(180mg)の水(1.9ml)およびジオキサン(1.9ml、合計濃度0.10M)の混合物中の溶液を80℃で3時間撹拌した。この反応混合物を室温に冷まし、EtOAcで希釈し、飽和 NaHCO_3 水溶液および塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5-ブロモ-3-(5-フルオロ-4-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-1-イル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリル(70mg、40%収率)を黄色の樹脂として得た： ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) (ppm) = 1.04(s, 3H) 1.70-1.79(m, 3H) 1.88-2.02(m, 1H) 4.91(br. s., 1H) 7.21(d, $J = 7.70$ Hz, 1H) 7.34(t, $J = 8.62$ Hz, 1H) 7.42-7.54(m, 2H) 8.09(d, $J = 1.83$ Hz, 1H) 8.64-8.71(m, 1H); ^{19}F NMR(377MHz, CDCl_3) (ppm) = -121.29(s, 1F); LC-MS(方法H) UV検出: 220nm, Rt = 1.51; MS: (M+1) = 413-415。

20

【0316】

e) 5-ブロモ-3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-4-オキソ-1-イソキノリル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリルの調製

室温の5-ブロモ-3-(5-フルオロ-4-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-4H-イソキノリン-1-イル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリル(0.15mmol、60mg)の、DMSO(0.3ml)およびジクロロメタン(1.0ml、合計濃度0.15M)の混合物中の溶液に、トリエチルアミン(5.0当量、0.73mmol、0.10ml)、続いて、 SO_3 ピリジン錯体(3.0当量、0.44mmol、69mg)を添加し、この反応混合物を室温で4時間撹拌した。この反応混合物を0.5Mのクエン酸水溶液を添加することにより失活させ、1時間激しく撹拌した。2つの相を分離し、水性相をジクロロメタンで抽出した。組み合わせた有機相を飽和 NaHCO_3 水溶液で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5-ブロモ-3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-4-オキソ-1-イソキノリル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリル(30mg、50%収率)を黄色の固体として得た： ^1H NMR(400MHz, CDCl_3) (ppm) = 1.61(s, 6H) 7.29(s, 1H) 7.42-7.52(m, 2H) 7.80(td, $J = 8.07, 4.77$ Hz, 1H) 8.08(d, $J = 1.83$ Hz, 1H) 8.59(d, $J = 1.83$ Hz, 1H); ^{19}F NMR(377MHz, CDCl_3) (ppm) = -109.82(s, 1F); LC-MS(方法H) UV検出: 220nm, Rt = 1.75; MS: (M+1) = 413。

30

40

【0317】

f) 5-ブロモ-3-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-1-イソキノリル)ピロロ[1,2-b]ピリダジン-7-カルボニトリルの調製

5-ブロモ-3-(5-フルオロ-3,3-ジメチル-4-オキソ-1-イソキノリル

50

g) ピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 7 - カルボニトリル (0 . 2 4 m m o l , 1 0 0 m g) の 2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ジメチル - イミダゾリジン (1 0 . 0 当量、 2 . 4 m m o l , 0 . 3 m l) 中の溶液を 1 0 5 で一晩攪拌した。この反応混合物を室温に冷まし、ジクロロメタンで希釈し、次いで、飽和 N a H C O ₃ 水溶液をゆっくりと添加することにより失活させた。1 M の N a O H 溶液を添加することにより pH を 8 ~ 9 に調節し、これら 2 つの相を分離した。水性相をジクロロメタンで抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、N a ₂ S O ₄ で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5 - プロモ - 3 - (4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - イソキノリル) ピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 7 - カルボニトリル (8 0 m g 、 8 0 % 収率) を明るい黄色の固体として得た：mp 1 9 0 ~ 1 9 2 ; 1 H N M R (4 0 0 M H z , C D C l ₃) (p p m) = 1 . 4 9 (s , 6 H) 7 . 2 1 - 7 . 2 6 (m , 1 H) 7 . 4 0 - 7 . 4 7 (m , 2 H) 7 . 6 5 (t d , J = 8 . 0 7 , 4 . 7 7 H z , 1 H) 8 . 0 6 (d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H) 8 . 6 3 (d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H) ; 1 9 F N M R (3 7 7 M H z , C D C l ₃) (p p m) = - 1 1 1 . 8 4 (t , J = 3 0 . 0 0 H z , 1 F) - 1 0 9 . 3 8 (d , J = 3 0 . 0 4 H z , 2 F) ; L C - M S (方法 H) U V 検出：2 2 0 n m , R t = 2 . 0 3 ; M S : (M + 1) = 4 3 5 。

【 0 3 1 8 】

g) 3 - (4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - イソキノリル) ピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 7 - カルボニトリルの調製

室温の 5 - プロモ - 3 - (4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - イソキノリル) ピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 7 - カルボニトリル (0 . 0 9 2 m m o l , 4 0 m g) のトルエン (1 M 、 0 . 9 2 m l) 中の溶液に、トリス (トリメチルシリルシラン) (3 . 0 当量、 0 . 2 7 m m o l , 6 9 m g) および A I B N (0 . 2 5 当量、 0 . 0 2 3 m m o l , 3 . 9 m g) を添加し、この反応混合物を 8 0 で 2 時間攪拌した。この反応混合物を室温に冷まし、次いで、減圧下で濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、3 - (4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - イソキノリル) ピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 7 - カルボニトリル (4 . 8 m g 、 1 3 % 収率) を黄色の固体として得た：mp 2 1 4 ~ 2 1 6 ; 1 H N M R (4 0 0 M H z , C D C l ₃) (p p m) = 1 . 3 7 (s , 6 H) 6 . 5 9 (d , J = 4 . 7 7 H z , 1 H) 7 . 1 3 (d d , J = 7 . 7 0 , 1 . 1 0 H z , 1 H) 7 . 2 7 - 7 . 3 4 (m , 2 H) 7 . 4 8 - 7 . 5 5 (m , 1 H) 7 . 9 8 (d , J = 2 . 2 0 H z , 1 H) 8 . 5 1 (d , J = 1 . 8 3 H z , 1 H) ; 1 9 F N M R (3 7 7 M H z , C D C l ₃) (p p m) = - 1 1 1 . 9 9 (t , J = 3 0 . 0 0 H z , 1 F) - 1 0 9 . 4 3 (d , J = 3 1 . 4 7 H z , 2 F) ; L C - M S (方法 H) U V 検出：2 2 0 n m , R t = 1 . 8 2 ; M S : (M + 1) = 3 5 5 。

【 0 3 1 9 】

実施例 4 : この実施例は 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 1 - (4 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - イル) イソキノリンの調製を例示する

a) エチル 4 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキシレートの調製

1 - アミノピロール (3 0 . 9 g 、 0 . 3 7 6 m o l) およびエチル (2 Z) - 2 - (エトキシメチレン) - 3 - オキソ - ブタノエート (7 0 g 、 0 . 3 7 6 m o l) の混合物を室温で 1 0 分間攪拌した。急速で発熱性の反応が生じた。この反応混合物は固体材料として析出し、これを石油エーテルで洗浄した。析出した固体材料の E t O H (5 0 0 m l) 中の溶液に塩酸 (1 6 5 m l) を添加した。得られた溶液を 8 0 に加熱し、8 0 で 1 6 時間攪拌した。冷却した後、溶液を水に注ぎ入れ、ジクロロメタンで抽出し、M g S O ₄ で乾燥させ、減圧下で蒸発させて濃縮し、シリカゲルによるクロマトグラフィによってさらに精製して 3 7 g の化合物 4 を 3 7 % の収率で得た。1 H N M R (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) (p p m) = 8 . 4 5 (s , 1 H) , 8 . 0 0 (d d , J = 2 . 6 , 1 . 5 H z , 1 H) , 7 . 0 2 (d d , J = 4 . 5 , 1 . 5 H z , 1 H) , 6 . 9 6 (

dd, $J = 4.4, 2.7 \text{ Hz}$, 1H), 4.29 (q, $J = 7.1 \text{ Hz}$, 2H), 2.75 (s, 3H), 1.32 (t, $J = 7.1 \text{ Hz}$, 3H)。

【0320】

b) 4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボン酸の調製

室温のエチル 4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボキシレート (38 g、186 mmol) の、MeOH (200 ml) および THF (200 ml) の混合物中の攪拌溶液に、300 ml の 10% NaOH 水溶液を添加した。この反応混合物を 60 で 2 時間攪拌した。冷却した後、この反応溶液を水に注ぎ入れ、濃塩酸で pH を 2 に酸性化した。沈殿物をろ過し、EA で洗浄し、減圧下で乾燥させて、27 g の 4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボン酸を 75% の収率で得た。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) (ppm) = 13.01 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.11-7.68 (m, 1H), 6.98 (dd, $J = 4.4, 1.3 \text{ Hz}$, 1H), 6.94 (dd, $J = 4.4, 2.6 \text{ Hz}$, 1H), 2.75 (s, 3H)。

10

【0321】

c) 4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボキサミドの調製

4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボン酸 (13 g、66.7 mmol) および POCl₃ (204 g、133.3 mmol) の混合物に、Et₃N (7.4 g、73.4 mmol) を室温で滴下した。次いで、この反応混合物を 90 に加熱し、16 時間攪拌した。過剰量の POCl₃ を減圧下で除去して粗塩化アシルを得、これを、次のステップにおいてさらに精製することなくそのまま用いた。

20

【0322】

塩化アシルの 50 ml のジクロロメタン中の溶液を 500 ml の水性アンモニアに 0 で 0.5 時間かけてゆっくりと添加した。1 時間攪拌した後、反応溶液を濃縮し、200 ml の水を添加した。沈殿物をろ過し、水で洗浄し、減圧下で乾燥させて 9 g の 4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボキサミドを 70% の収率で得た。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) (ppm) = 8.22 (s, 1H), 7.95 (d, $J = 2.9 \text{ Hz}$, 2H), 7.34 (d, $J = 2.8 \text{ Hz}$, 1H), 6.14 (s, 2H), 2.70 (s, 3H)。

30

【0323】

d) 4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボニトリルの調製

4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボキサミド (9 g、51.4 mmol) のトルエン (500 ml) 中の懸濁液に、POCl₃ (40 ml) を添加した。添加の後、次いで、この反応を 50 に加熱し、2 時間攪拌した。冷却した後、反応溶液混合物を氷水に注ぎ入れ、CH₂Cl₂ で抽出し、有機相を MgSO₄ で乾燥させ、減圧下で蒸発させて濃縮し、シリカゲルによるクロマトグラフィによってさらに精製して 3 g の 4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボニトリルを 37% の収率で得た。

40

¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) (ppm) = 8.35 (s, 1H), 8.09-7.97 (m, 1H), 7.14-6.86 (m, 2H), 2.63 (s, 3H)。

【0324】

e) 5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-1-(4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-イル)イソキノリンの調製

0 の 4-メチルピロロ[1,2-b]ピリダジン-3-カルボニトリル (1.57 g、10 mmol)、TFA (18.7 ml、200 mmol) および Tf₂O (0.33 ml、2 mmol) のジクロロメタン (40 ml) 中の溶液に、3-(2-フルオロフェニル)-2,3-ジメチル-ブタン-2-オール (6 g、30 mmol) を添加し、この反応混合物を 0 で 2 時間攪拌した。この反応溶液混合物を氷水に注ぎ入れ、水性 NaHCO₃ で塩基性化した。水性相をジクロロメタンで抽出し、組み合わせた有機抽出物を M

50

g S O₄で乾燥させ、減圧下で濃縮し、シリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 1 - (4 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - イル) イソキノリンを得た。1 H NMR (4 0 0 M H z , C D C l₃) (p p m) = 7 . 6 9 (s , 1 H) , 7 . 6 1 (s , 1 H) , 7 . 1 5 - 7 . 1 0 (d d , 2 H) , 6 . 8 7 - 6 . 8 5 (d d , 1 H) , 6 . 8 1 - 6 . 7 9 (d d , 1 H) , 6 . 4 9 - 6 . 4 8 (d d , 1 H) , 2 . 2 6 (s , 3 H) .) , 1 . 4 4 - 1 . 4 3 (d , 6 H) , . 1 . 2 9 (s , 6 H) 。

【 0 3 2 5 】

実施例 5 : この実施例は 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 1 - (2 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - イル) イソキノリンの調製を例示する

10

a) 2 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボニトリルの調製

室温の NaH (1 1 . 4 g , 2 8 6 m m o l , 6 0 %) の 5 0 0 m l の乾燥 Et₂O 中の懸濁液に、室温で 3 , 3 - ジメトキシプロパンニトリル化合物 1 (3 0 g , 2 6 0 m m o l) を滴下し、続いて、CH₃CO₂Me (4 5 . 6 g , 2 5 0 m m o l) を滴下した。次いで、この反応混合物を室温で 2 日間攪拌した。沈殿物をろ過し、Et₂O で洗浄し、減圧中で乾燥させて、2 6 g の 2 - (ジメトキシメチル) - 3 - オキソ - ブタンニトリルをナトリウム塩として 6 5 % の収率で得た。

【 0 3 2 6 】

室温の 2 - (ジメトキシメチル) - 3 - オキソ - ブタンニトリル (2 6 g , 1 6 5 . 6 m m o l) のナトリウム塩の EtOH (5 0 0 m l) 中の溶液に、塩酸 (3 0 m l) および 1 - アミノピロール (1 3 . 6 g , 1 6 5 . 6 m m o l) を添加した。次いで、この反応を 8 0 ° に加熱し、2 時間攪拌した。塩酸 (4 0 m l) および EtOH (4 0 m l) を 8 0 ° で添加した。1 2 時間攪拌した後、この反応混合物を室温に冷まし、水に注ぎ入れた。水性相をジクロロメタンで抽出し、MgSO₄で乾燥させ、減圧下で蒸発させ、シリカゲルによるクロマトグラフィによってさらに精製して 8 g の 2 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボニトリルを 2 5 % の収率で得た。1 H NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d₆) (p p m) = 8 . 6 0 (s , 1 H) , 8 . 0 2 (s , 1 H) , 6 . 9 7 (d d , J = 4 . 5 , 2 . 6 H z , 1 H) , 6 . 8 2 (d d , J = 4 . 5 , 1 . 1 H z , 1 H) , 2 . 4 8 (s , 3 H) 。

20

【 0 3 2 7 】

a) 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 1 - (2 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - イル) イソキノリンの調製

30

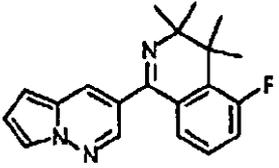
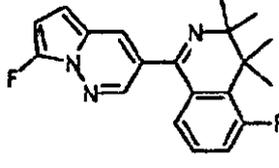
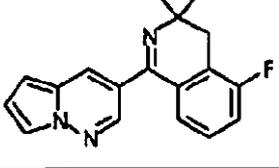
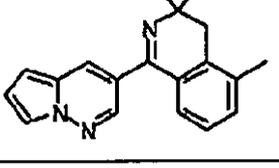
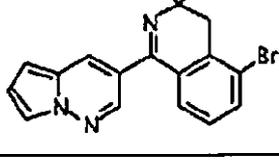
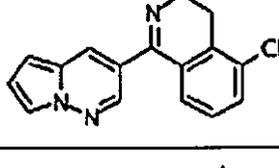
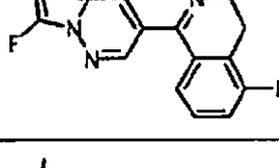
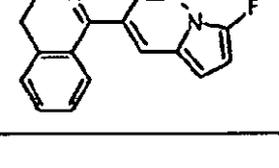
2 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボニトリル (1 . 5 7 g , 1 0 m m o l) の濃 H₂SO₄ (2 1 m l) 中の溶液に、0 ° で、3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 , 3 - ジメチル - ブタン - 2 - オール (6 g , 3 0 m m o l) を添加し、この反応混合物を 0 ° で 5 時間攪拌した。この反応混合物を氷水に注ぎ入れ、水性 NaHCO₃ で塩基性化し、水性相をジクロロメタンで抽出し、組み合わせた有機相を MgSO₄ で乾燥させ、減圧下で蒸発させ、シリカゲルによるクロマトグラフィによって精製して、5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 1 - (2 - メチルピロロ [1 , 2 - b] ピリダジン - 3 - イル) イソキノリンを得た。1 H NMR (4 0 0 M H z , C D C l₃) (p p m) = 7 . 8 7 (s , 1 H) , 7 . 7 5 - 7 . 7 4 (d , 1 H) , 7 . 1 5 - 7 . 1 1 (d d , 2 H) , 6 . 8 7 - 6 . 8 4 (d d , 2 H) , 6 . 5 8 - 6 . 5 7 (d d , 1 H) , 2 . 2 8 (s , 3 H) , . 1 . 4 5 - 1 . 4 4 (d , 6 H) , . 1 . 3 1 (s , 6 H) 。

40

【 0 3 2 8 】

【表 7 - 1】

表 E: 式 I の化合物の物理データ

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 1		1.19	322	H	121 - 125
E 2		1.29	340	H	112 - 115
E 3		0.78	294	G	
E 4		0.78	290	G	
E 5		0.87	356	G	
E 6		0.88	310	G	
E 7		1.08	312	H	
E 8		0.91	294	H	

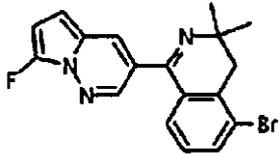
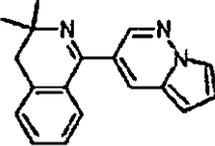
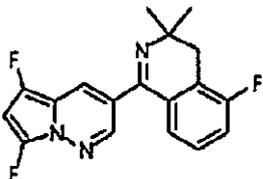
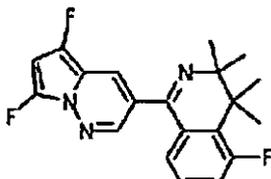
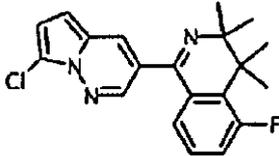
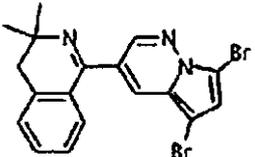
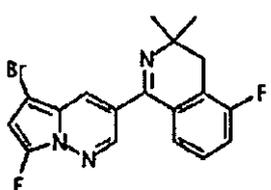
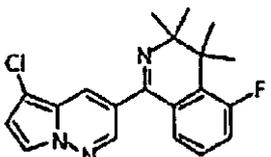
10

20

30

40

【表 7 - 2】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 9		1.31	372	H	
E 10		0.88	276	H	
E 11		0.89	330	G	114 - 115
E 12		0.98	358	G	126 - 127
E 13		1.50	356	H	126 - 129
E 14		1.42	434	H	
E 15		1.64	392	H	
E 16		1.68	356	H	

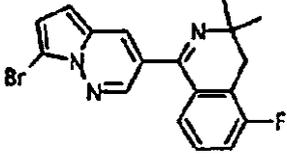
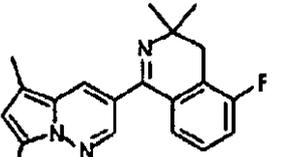
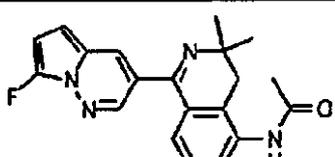
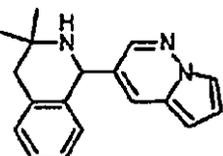
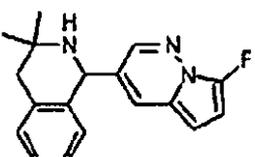
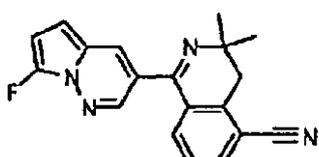
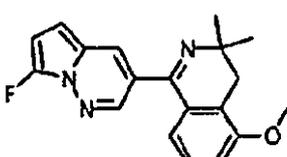
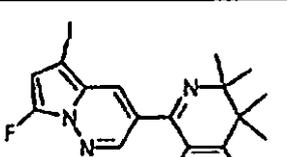
10

20

30

40

【表 7 - 3】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 17		1.35	374	H	
E 18		1.15	326	H	
E 19		0.58	351	G	
E 20		0.71	278	G	
E 21		0.73	296	G	
E 22		0.87	319	G	
E 23		0.76	324	G	
E 24		1.86	466	H	

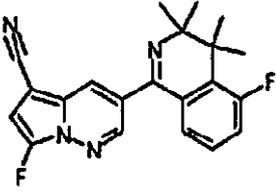
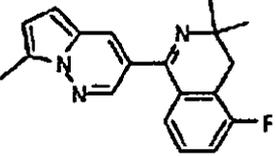
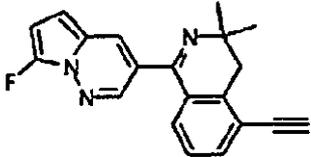
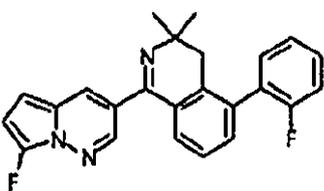
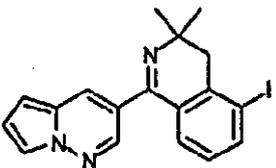
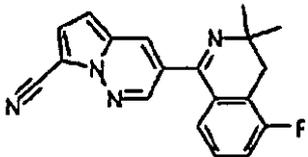
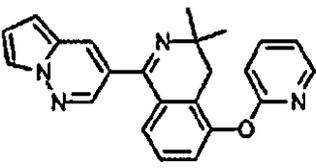
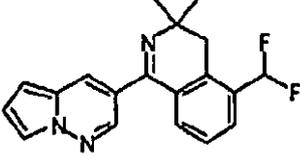
10

20

30

40

【表 7 - 4】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 25		1.89	365	H	128 - 130
E 26		1.11	308	H	
E 27		0.81	318	G	
E 28		0.94	388	G	
E 29		0.91	402	G	
E 30		1.56	319	H	118 - 136
E 31		0.79	369	G	
E 32		0.81	326	G	

10

20

30

40

【表 7 - 5】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 33		0.69	304	G	64 - 66
E 34		0.65	292	G	221 - 224
E 35		2.20	408	H	
E 36		2.45	458	H	
E 37		1.57	448	H	
E 38		2.15	574	H	
E 39		0.81	342	G	
E 40		1.77	364	H	

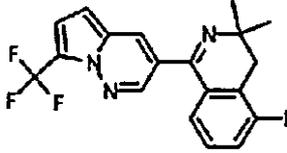
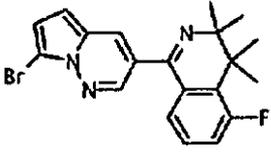
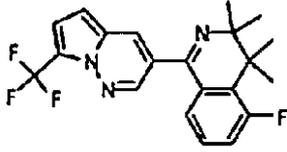
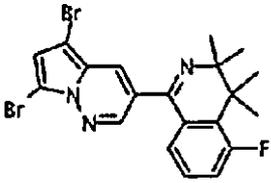
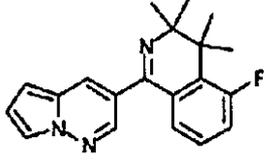
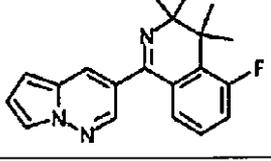
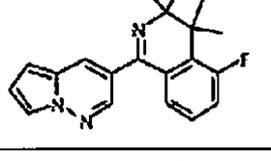
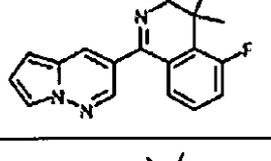
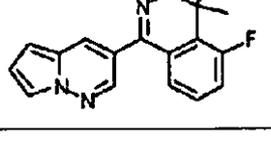
10

20

30

40

【表 7 - 6】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] ⁺ (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 41		1.26	470	G	50 - 53
E 42		1.52	400	H	136 - 139
E 43		2.03	390	H	
E 44		2.11	480	H	110 - 135
E 45	 HCl	1.19	322	H	
E 46	 HBr	1.19	322	H	
E 47	 	1.19	322	H	
E 48	 	1.19	322	H	
E 49	 	1.19	322	H	

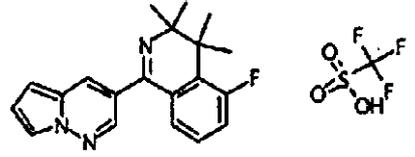
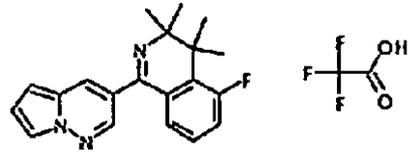
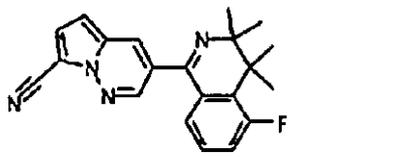
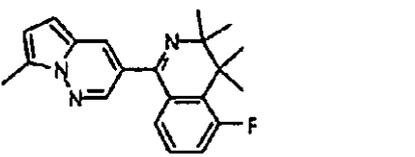
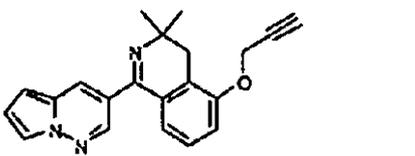
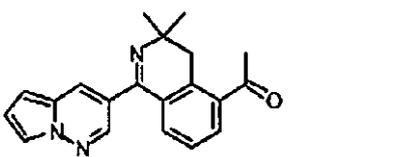
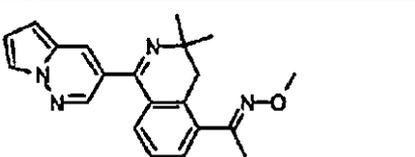
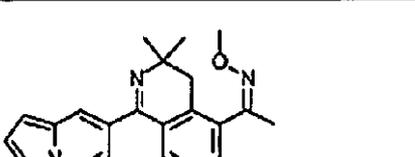
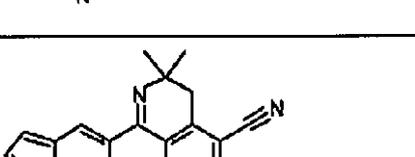
10

20

30

40

【表 7 - 7】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 50		1.19	322	H	
E 51		1.19	322	H	
E 52		1.78	347	H	177 - 180
E 53		1.27	336	H	117 - 120
E 54		0.78	330	G	
E 55		0.70	318	G	
E 56		0.82	347	G	
E 57		0.79	347	G	
E 58		0.81	301	G	139 - 142

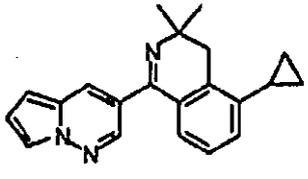
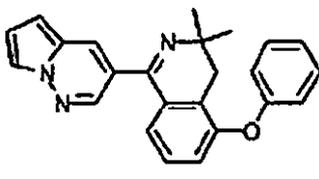
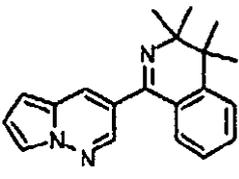
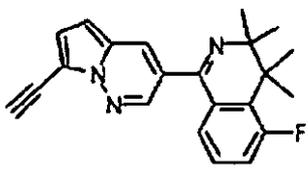
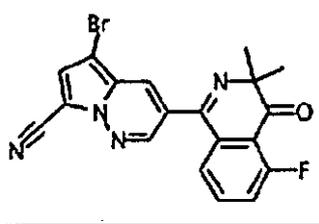
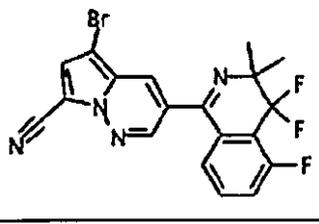
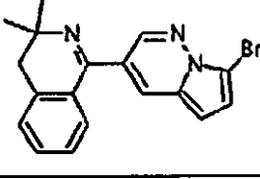
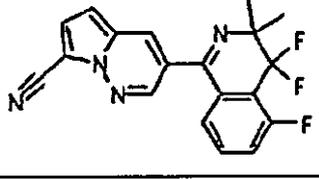
10

20

30

40

【表 7 - 8】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 59		0.87	316	G	
E 60		0.96	368	G	
E 61		1.00	304	H	
E 62		1.50	346	H	
E 63		1.75	413	H	
E 64		2.03	435	H	190 - 192
E 65		1.06	354	H	
E 66		1.81	355	H	214 - 216

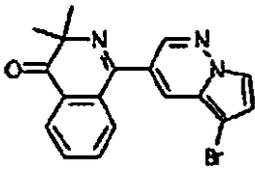
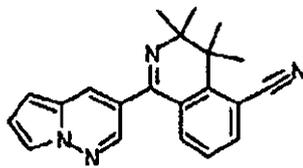
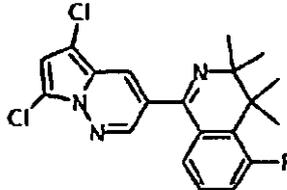
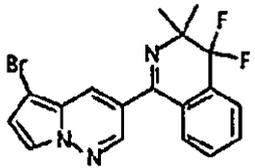
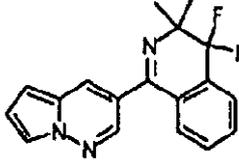
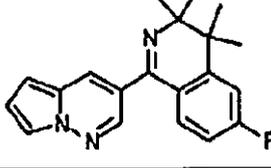
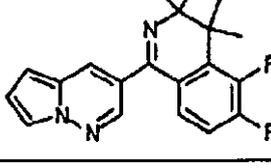
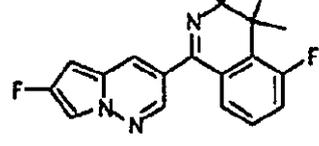
10

20

30

40

【表 7 - 9】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 67		1.82	368	H	148 - 150
E 68		1.28	329	H	
E 69		2.03	390	H	130 - 133
E 70		2.12	390	H	
E 71		1.35	312	H	
E 72		0.74	322	G	57 - 60
E 73		0.88	340	G	87 - 89
E 74		0.95	340	G	128 - 130

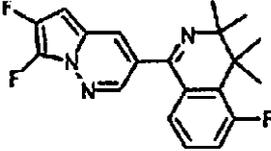
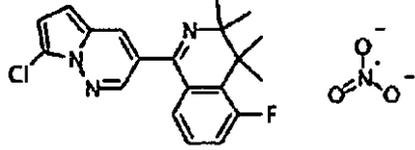
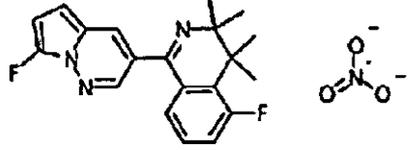
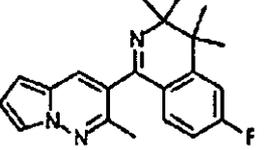
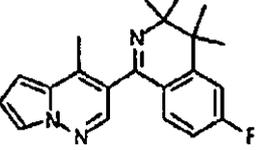
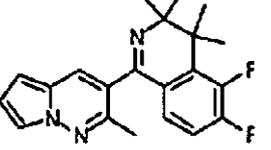
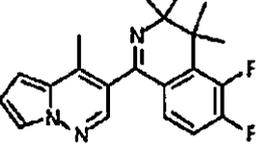
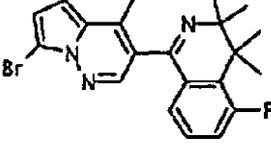
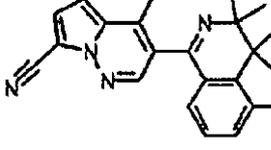
10

20

30

40

【表 7 - 10】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 75		1.03	358	G	152 - 154
E 76		1.50	356	H	
E 77		1.29	340	H	
E 78		0.83	336	G	
E 79		0.99	336	G	
E 80		0.96	354	G	94 - 97
E 81		1.02	354	G	
E 82		1.09	414	G	104 - 106
E 83		1.12	361	G	174 - 176

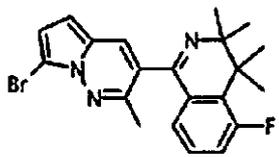
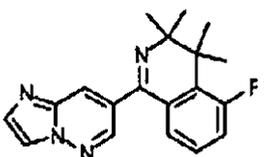
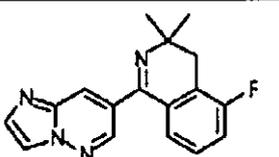
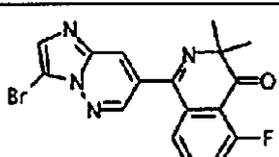
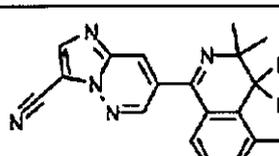
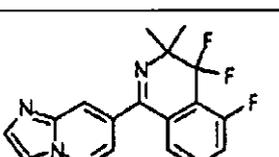
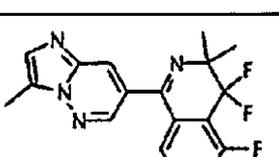
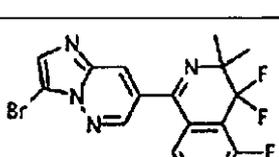
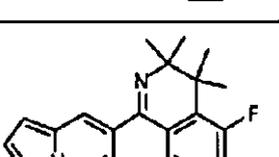
10

20

30

40

【表 7 - 1 1】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 84		1.11	414	G	121 - 123
E 85		0.92	323	G	177 - 180
E 86		0.81	295	G	153 - 155
E 87		0.92	388	G	68 - 70
E 88		1.01	356	G	168 - 170
E 89		0.93	331	G	152 - 155
E 90		0.96	345	G	150 - 152
E 91		1.06	410	G	172 - 175
E 92		0.93	336	G	

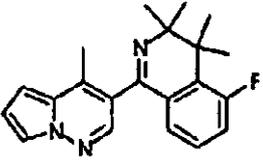
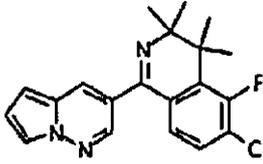
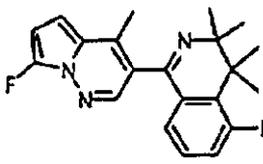
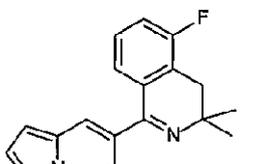
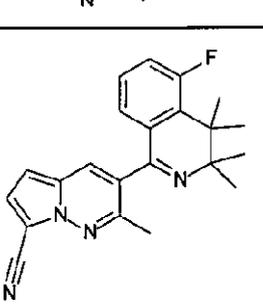
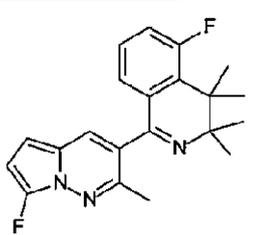
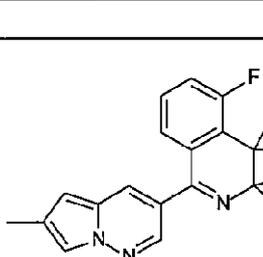
10

20

30

40

【表 7 - 1 2】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実測値)	LC-MS 法	MP °C
E 93		0.93	336	G	118 - 121
E 94		1.02	356	G	150 - 153
E 95		0.99	354	G	122 - 124
E 96		0.84	308	G	104 - 106
E 97		1.13	361	G	174 - 176
E 98		0.98	354	G	121 - 123
E 99		0.82	336	G	

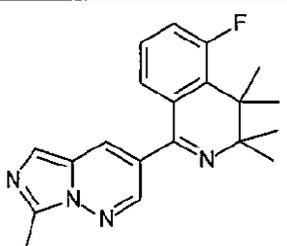
10

20

30

40

【表 7 - 1 3】

No.	化合物	RT (min)	[M+H] (実 測値)	LC-MS 法	MP °C
E 100		0.88	337	G	

10

【 0 3 2 9 】

【表 8】

表 E(続き): 式 I の化合物の物理データ

No.	化合物	NMR
E 101		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) 8.25 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.25 – 7.19 (m, 1H), 7.18 – 7.07 (m, 2H), 6.50 (s, 1H), 6.28 (d, $J = 3.9$ Hz, 1H), 4.12 (s, 3H), 1.41 (s, 6H), 1.26 (s, 6H). ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ (ppm) -110.50 (1F, s).
E 102		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) 8.37 (d, $J = 1.4$ Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.29 – 7.13 (m, 3H), 6.98 – 6.84 (m, 1H), 6.60 (d, $J = 4.2$ Hz, 1H), 2.87 – 2.69 (m, 2H), 1.78 – 1.52 (m, 2H), 1.19 (s, 3H), 1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H). ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ (ppm) -116.48 (1F, s).
E 103		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) 8.41 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.30 – 7.12 (m, 3H), 6.93 – 6.87 (m, 1H), 6.62 (d, $J = 3.3$ Hz, 1H), 2.80 (s, 2H), 1.93 – 1.39 (m, 10H). ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ (ppm) -116.43 (1F, s).
E 104		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) 8.39 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.28 – 7.09 (m, 3H), 6.89 (s, 1H), 6.60 (d, $J = 3.9$ Hz, 1H), 2.76 (s, 2H), 1.72 – 1.40 (m, 4H), 0.94 (t, $J = 7.4$ Hz, 6H).
E 105		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) 8.36 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.31 – 7.12 (m, 3H), 6.90 (s, 1H), 6.61 (d, $J = 3.5$ Hz, 1H), 2.79 (q, $J = 16.2$ Hz, 2H), 1.71 – 1.32 (m, 4H), 1.22 (s, 3H), 0.92 (t, $J = 6.6$ Hz, 3H).
E 106		^1H NMR (400 MHz, DMSO) δ (ppm) 8.31 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.31 – 7.21 (m, 2H), 7.10 (d, $J = 4.5$ Hz, 1H), 7.04 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 6.78 (d, $J = 4.5$ Hz, 1H), 1.42 (d, $J = 5.3$ Hz, 3H), 1.38 (s, 3H), 1.35 (s, 3H), 1.16 (s, 3H).
E 107		^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (ppm) 8.28 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.21 – 7.12 (m, 1H), 7.05 (dd, $J = 12.1$, 8.3 Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 4.5$ Hz, 1H), 6.84 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 6.69 (d, $J = 4.5$ Hz, 1H), 1.50 (s, 12H).

10

20

30

40

生物学的実施例

ボトリオチニアフッケリアナ (*Botryotinia fuckeliana*) (ボトリチスシネレア (*Botrytis cinerea*)) / 液体培地 (灰色カビ病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (Vogel's 液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を添加を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0331】

表 E の化合物 E 1、E 2、E 3、E 4、E 5、E 6、E 7、E 8、E 9、E 10、E 11、E 12、E 13、E 15、E 16、E 17、E 18、E 20、E 21、E 22、E 23、E 24、E 25、E 26、E 27、E 28、E 29、E 30、E 31、E 32、E 34、E 35、E 36、E 37、E 38、E 39、E 40、E 41、E 42、E 43、E 44、E 45、E 46、E 47、E 48、E 49、E 50、E 51、E 52、E 53、E 54、E 56、E 57、E 58、E 59、E 60、E 61、E 62、E 65、E 66、E 68、E 69、E 70、E 71、E 72、E 73、E 74、E 75、E 76、E 77、E 78、E 79、E 80、E 81、E 82、E 83、E 84、E 85、E 86、E 88、E 89、E 90、E 91、E 92、E 93、E 94 および E 95 が、200 ppm で、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示す未処理の対照葉片と比した場合に、このテストにおいて少なくとも 80% の病害防除をもたらす。

10

【0332】

フザリウムクルモルム (*Fusarium culmorum*) / 液体培地 (胴枯れ病)

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合する。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を添加を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 3 ~ 4 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

20

【0333】

表 E の化合物 E 1、E 2、E 3、E 5、E 6、E 7、E 9、E 12、E 13、E 22、E 24、E 26、E 27、E 29、E 30、E 32、E 42、E 45、E 46、E 47、E 48、E 49、E 50、E 51、E 52、E 53、E 58、E 60、E 61、E 66、E 71、E 72、E 73、E 74、E 75、E 76、E 77、E 78、E 79、E 80、E 81、E 84 および E 90 が、200 ppm で、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示す未処理の対照葉片と比した場合に、このテストにおいて少なくとも 80% の病害防除をもたらす。

30

【0334】

ゲーウマノミセスグラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) / 液体培地 (穀類の立枯病)

極低温保管しておいた真菌の菌糸体断片を栄養液体培地 (PDB ジャガイモブドウ糖液体培地) に直接混合した。テスト化合物の (DMSO) 溶液をマイクロタイタープレート (96 ウェル型) に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を添加を加える。テストプレートを 24 でインキュベートし、適用から 4 ~ 5 日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

40

【0335】

表 E の化合物 E 1、E 2、E 3、E 15、E 17、E 18、E 21、E 27、E 30、E 31、E 42、E 54、E 75、E 76、E 77 および E 84 が、200 ppm で、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示す未処理の対照葉片と比した場合に、このテストにおいて少なくとも 80% の病害防除をもたらす。

【0336】

グロメララゲナリウム (*Glomerella lagenarium*) (コレトリカムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*)) / 液体培

50

地（炭疽病）

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地（PDBジャガイモブドウ糖液体培地）に直接混合する。テスト化合物の（DMSO）溶液をマイクロタイタープレート（96ウェル型）に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を添加を加える。テストプレートを24でインキュベートし、適用から3～4日間後に、成長の阻害を測光法により計測する。

【0337】

表Eの化合物E1、E2、E3、E4、E5、E6、E7、E8、E9、E10、E11、E12、E13、E15、E16、E17、E18、E21、E22、E23、E24、E25、E26、E27、E28、E29、E30、E32、E34、E35、E37、E40、E42、E43、E45、E46、E47、E48、E49、E50、E51、E52、E53、E56、E57、E58、E60、E61、E62、E66、E67、E68、E69、E70、E71、E72、E73、E74、E75、E76、E77、E78、E79、E80、E81、E82、E83、E84、E85、E89、E90、E92、E93、E94およびE95が、200ppmで、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示す未処理の対照葉片と比した場合に、このテストにおいて少なくとも80%の病害防除をもたらす。

10

【0338】

モノグラフエラニバリス（*Monographella nivalis*）（コムギ赤かび病菌（*Microdochium nivale*））/液体培地（穀類の根腐れ病）

20

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地（PDBジャガイモブドウ糖液体培地）に直接混合する。テスト化合物の（DMSO）溶液をマイクロタイタープレート（96ウェル型）に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を添加を加える。テストプレートを24でインキュベートし、適用から4～5日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

【0339】

表Eの化合物E1、E2、E3、E4、E5、E6、E7、E8、E9、E10、E13、E15、E17、E18、E22、E24、E25、E26、E27、E29、E30、E32、E37、E38、E41、E42、E43、E45、E46、E47、E48、E49、E50、E51、E52、E53、E60、E62、E65、E66、E67、E69、E70、E71、E72、E73、E74、E76、E77、E80、E82、E84、E85およびE90が、200ppmで、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示す未処理の対照葉片と比した場合に、このテストにおいて少なくとも80%の病害防除をもたらす。

30

【0340】

マイコスファエレラグラミニコラ（*Mycosphaerella graminicola*）（セプトリアトリティシ（*Septoria tritici*））/液体培地（葉枯病）

極低温保管しておいた真菌の分生子を栄養液体培地（PDBジャガイモブドウ糖液体培地）に直接混合する。テスト化合物の（DMSO）溶液をマイクロタイタープレート（96ウェル型）に入れた後、真菌の芽胞を含有する栄養液体培地を添加を加える。テストプレートを24でインキュベートし、適用から4～5日間後に、成長の阻害を測光法により測定する。

40

【0341】

表Eの化合物E3、E5、E15、E18、E24、E27、E29、E30、E38、E60およびE76が、200ppmで、同一の条件下において、大幅な病害の発生を示す未処理の対照葉片と比した場合に、このテストにおいて少なくとも80%の病害防除をもたらす。

【 国际调查报告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No. PCT/CN2015/072369
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER C07D 401/14(2006.01)i; C07D 403/14(2006.01)i; A01N 43/42(2006.01)i; A01N 43/58(2006.01)i; A01P 3/00(2006.01)i According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D401; C07D403; A01N43; A01P3 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) DWPI, SIPOABS, CNABS, CPRSABS, CNKI, REGISTRY, CAPLUS (STN), SYNGENTA, pyridazine, phytopathogenic, fungicidal, Search according to the structure of compound (I) in claim 1		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2010124619 A1 (UNIV EAST CHINA SCIENCE & TECH) 04 November 2010 (2010-11-04) the whole document	1-14
A	CN 101906096 A (UNIV EAST CHINA SCI & TECHNOLOGY) 08 December 2010 (2010-12-08) the whole document	1-14
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 26 April 2015		Date of mailing of the international search report 13 May 2015
Name and mailing address of the ISA/CN STATE INTELLECTUAL PROPERTY OFFICE OF THE P.R.CHINA(ISA/CN) 6,Xitucheng Rd., Jimen Bridge, Haidian District, Beijing 100088, China Facsimile No. (86-10)62019451		Authorized officer CHANG, Xiaoyu Telephone No. (86-10)62084403

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/CN2015/072369

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)			Publication date (day/month/year)
WO	2010124619	A1	04 November 2010	CN	101875653	B	24 December 2014
				CN	101875653	A	03 November 2010
CN	101906096	A	08 December 2010	CN	101906096	B	05 June 2013

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I テーマコード(参考)
A 0 1 N 43/90 1 0 4

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US

(74)代理人 100088694

弁理士 弟子丸 健

(74)代理人 100094569

弁理士 田中 伸一郎

(74)代理人 100084663

弁理士 箱田 篤

(74)代理人 100093300

弁理士 浅井 賢治

(74)代理人 100119013

弁理士 山崎 一夫

(74)代理人 100123777

弁理士 市川 さつき

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(72)発明者 ボウ ハムダン ファルハーン

スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

(72)発明者 カランタ ラウラ

スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

(72)発明者 トラー ステファン

スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

(72)発明者 ランバース クレメンス

スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ ク
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

(72)発明者 ル ロン

中華人民共和国 2 0 0 0 3 2 シャンハイ シューファイ ディストリクト リンリン ロード
ナンバー 3 4 5 チャイニーズ アカデミー オブ サイエンス シャンハイ インスティ
チュート オブ オーガニック ケミストリー

(72)発明者 ル チャン

中華人民共和国 2 0 0 0 3 2 シャンハイ シューファイ ディストリクト リンリン ロード
ナンバー 3 4 5 チャイニーズ アカデミー オブ サイエンス シャンハイ インスティ
チュート オブ オーガニック ケミストリー

Fターム(参考) 4C050 AA01 BB04 CC07 EE02 FF02 FF03 FF05 GG01 GG02 HH04

4C086 AA01 AA02 AA03 CB05 MA01 MA04 NA14 ZB32

4H011 AA01 BB09 DA12 DD03

【要約の続き】
用に関する。